

日本国特許庁 26.09.2005
 JAPAN PATENT OFFICE

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日 2004年 9月 28日
 Date of Application:

出願番号 特願 2004-282814
 Application Number:

パリ条約による外国への出願に用いる優先権の主張の基礎となる出願の国コードと出願番号

The country code and number of your priority application, to be used for filing abroad under the Paris Convention, is

J P 2004-282814

出願人 大塚製薬株式会社
 Applicant(s):

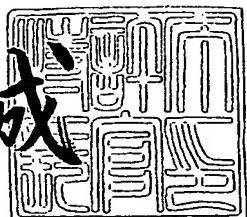
BEST AVAILABLE COPY

2005年11月11日

特許庁長官
 Commissioner,
 Japan Patent Office

中 鳩

誠



【書類名】 特許願
【整理番号】 6462004JP
【提出日】 平成16年 9月28日
【あて先】 特許庁長官殿
【国際特許分類】 C07D215/00
【発明者】
 【住所又は居所】 徳島県板野郡北島町江尻字夷ノ本 24-13
 【氏名】 黒田 武志
【発明者】
 【住所又は居所】 東京都目黒区南3-8-16 クレール南 205
 【氏名】 山内 孝仁
【発明者】
 【住所又は居所】 德島県鳴門市撫養町斎田字東發 8-6
 【氏名】 篠原 友一
【発明者】
 【住所又は居所】 德島県板野郡北島町中村字明神下 47-4 ワイズアベニューC
 【氏名】 棟 大島 邦生
【発明者】
 【住所又は居所】 德島県板野郡藍住町住吉字神藏 141-17
 【氏名】 北島 千春
【発明者】
 【住所又は居所】 德島県徳島市佐古一番町 5-22
 【氏名】 永尾 仁
【発明者】
 【住所又は居所】 德島県徳島市城東町 2-4-28-401
 【氏名】 福島 多恵
【発明者】
 【住所又は居所】 德島県板野郡北島町鯛浜字西中野 103番地 11
 【氏名】 石山 広信
【発明者】
 【住所又は居所】 德島県徳島市川内町平石住吉 225番地 13
 【氏名】 太田 和秀
【発明者】
 【住所又は居所】 德島県板野郡藍住町住吉字乾 77番地 6
 【氏名】 高野 雅明
【発明者】
 【住所又は居所】 德島県徳島市東新町 2丁目 20番地 704
 【氏名】 住田 卓美
【特許出願人】
 【識別番号】 000206956
 【氏名又は名称】 大塚製薬株式会社
【代理人】
 【識別番号】 100065215
 【弁理士】
 【氏名又は名称】 三枝 英二
【選任した代理人】
 【識別番号】 100076510
 【弁理士】
 【氏名又は名称】 掛樋 悠路

【選任した代理人】

【識別番号】 100086427
【弁理士】
【氏名又は名称】 小原 健志
【電話番号】 06-6203-0941
【連絡先】 担当

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 001616
【納付金額】 16,000円

【提出物件の目録】

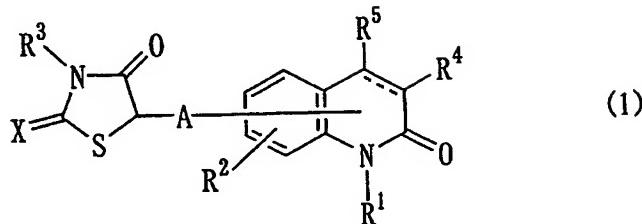
【物件名】 特許請求の範囲 1
【物件名】 明細書 1
【物件名】 図面 1
【物件名】 要約書 1
【包括委任状番号】 0313039

【書類名】特許請求の範囲

【請求項 1】

一般式 (1)

【化1】



[式中、Aは、直接結合、低級アルキレン基又は低級アルキリデン基を示す。
Xは、酸素原子又は硫黄原子を示す。

R⁴及びR⁵は、それぞれ水素原子を示す。

カルボスチリル骨格の3, 4位の結合は一重結合又は二重結合を示す。

カルボスチリル骨格の3, 4位の結合が二重結合を示す場合、R⁴及びR⁵は互いに結合して基-C H=C H-C H=C H-を形成してもよい。

R¹は、下記(1-1)～(1-17)で示されるいずれかの基を示す。

(1-1) 水素原子

(1-2) 低級アルキル基

(1-3) フェニル環上に置換基としてフェニル基、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、基-(B)₁NR⁶R⁷、ニトロ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、フェニル低級アルコキシ基、フェノキシ基、ピペリジニル低級アルコキシカルボニル基、シクロアルキル基を有することのあるアミノ低級アルコキシカルボニル基、2-イミダゾリン環上に置換基として低級アルキルチオ基を有することのある2-イミダゾリニルカルボニル基、3-ピロリン環上に置換基として低級アルキル基を有することのある3-ピロリニルカルボニル基、チアゾリジニルカルボニル基、3-アザビシクロ[3.2.2]ノニルカルボニル基及びピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニルカルボニル基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基

(1-4) シクロアルキル低級アルキル基

(1-5) フェノキシ低級アルキル基

(1-6) ナフチル低級アルキル基

(1-7) 低級アルコキシ低級アルキル基

(1-8) カルボキシ低級アルキル基

(1-9) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基

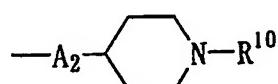
(1-10) ピリジン環上に置換基としてハロゲン原子；ピペリジニル基；モルホリノ基；ピペラジン環上に置換基としてフェニル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペラジニル基；チエニル基；フェニル基；ピリジル基及びアミノ基上に低級アルキル基を有することのあるアニリノ基なる群から選ばれた基を有することのあるピリジル低級アルキル基

(1-11) シアノ低級アルキル基

(1-12) 基-A₁-CONR⁸R⁹

(1-13) 基

【化2】



(1-14) フェニル基

- (1-15) キノリル低級アルキル基
 (1-16) 低級アルコキシ低級アルコキシ置換低級アルキル基
 (1-17) 水酸基置換低級アルキル基；
 R²は、下記(2-1)～(2-33)で示されるいずれかの基を示す。
- (2-1) 水素原子
 - (2-2) 低級アルコキシ基
 - (2-3) 低級アルキル基
 - (2-4) カルボキシ低級アルコキシ基
 - (2-5) 低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基
 - (2-6) 水酸基
 - (2-7) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子を有することのある低級アルキルチオ基、低級アルコキシ基、ニトロ基、低級アルキルスルホニル基、低級アルコキシカルボニル基、フェニル低級アルケニル基、低級アルカノイルオキシ基及び1, 2, 3-チオジアゾリル基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基
 - (2-8) ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシ基
 - (2-9) 低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基
 - (2-10) 低級アルケニルオキシ基
 - (2-11) ピリジン環上に置換基としてハロゲン原子置換もしくは非置換の低級アルキル基を有することのあるピリジル低級アルコキシ基
 - (2-12) 低級アルキニルオキシ基
 - (2-13) フェニル低級アルキニルオキシ基
 - (2-14) フェニル低級アルケニルオキシ基
 - (2-15) フラン環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基を有することのあるフリル低級アルコキシ基
 - (2-16) テトラゾール環上に置換基としてフェニル低級アルキル基、フェニル基及びシクロアルキル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるテトラゾリル低級アルコキシ基
 - (2-17) 1, 2, 4-オキサジアゾール環上に置換基としてフェニル基（フェニル環上に低級アルキル基が置換していてもよい）を有することのある1, 2, 4-オキサジアゾリル低級アルコキシ基
 - (2-18) イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリル低級アルコキシ基
 - (2-19) 1, 3, 4-オキサジアゾール環上に置換基としてフェニル基（フェニル環上に低級アルキル基が置換していてもよい）を有することのある1, 3, 4-オキサジアゾリル低級アルコキシ基
 - (2-20) 低級アルカノイル低級アルコキシ基
 - (2-21) チアゾール環上に置換基としてフェニル基（フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい）及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるチアゾリル低級アルコキシ基
 - (2-22) ピペリジン環上に置換基としてベンゾイル基（フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい）を有することのあるピペリジニルオキシ基
 - (2-23) チエニル低級アルコキシ基
 - (2-24) フェニルチオ低級アルコキシ基
 - (2-25) 低級アルキル基を有することのあるカルバモイル置換低級アルコキシ基
 - (2-26) ベンゾイル低級アルコキシ基
 - (2-27) ピリジルカルボニル低級アルコキシ基
 - (2-28) イミダゾール環上に置換基としてフェニル低級アルキル基を有することのあるイミダゾリル低級アルコキシ基

- (2-29) フェノキシ低級アルコキシ基
- (2-30) フェニル低級アルコキシ置換低級アルコキシ基
- (2-31) 2, 3-ジヒドロー1H-インデニルオキシ基
- (2-32) イソインドリン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるイソインドリニル低級アルコキシ基
- (2-33) フェニル基；
R³は、下記(3-1)～(3-19)で示されるいずれかの基を示す。
- (3-1) 水素原子
- (3-2) 低級アルキル基
- (3-3) 水酸基置換低級アルキル基
- (3-4) シクロアルキル低級アルキル基
- (3-5) カルボキシ低級アルキル基
- (3-6) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基
- (3-7) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル基、低級アルコキシカルボニル基、フェノキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルホニル基、フェニル低級アルコキシ基及び低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基
- (3-8) ナフチル低級アルキル基
- (3-9) フラン環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基を有することのあるフリル低級アルキル基
- (3-10) チアゾール環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキル基（低級アルキル基上にハロゲン原子が置換していてもよい）を有することのあるフェニル基なる群から選ばれた基を有することのあるチアゾリル低級アルキル基
- (3-11) テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル低級アルキル基
- (3-12) ベンゾチオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾチエニル低級アルキル基
- (3-13) 低級アルキニル基
- (3-14) 低級アルケニル基
- (3-15) フェニル低級アルケニル基
- (3-16) ベンゾイミダゾリル低級アルキル基
- (3-17) ピリジル低級アルキル基
- (3-18) イミダゾール環上に置換基としてフェニル低級アルキル基を有することのあるイミダゾリル低級アルキル基
- (3-19) キノリル低級アルキル基；
Bは、カルボニル基又は基-NHCO-を示す。

1は、0又は1を示す。

R⁶及びR⁷は、各々下記(4-1)～(4-79)で示されるいずれかの基を示す。

- (4-1) 水素原子
- (4-2) 低級アルキル基
- (4-3) 低級アルカノイル基
- (4-4) ハロゲン原子を有することのある低級アルキルスルホニル基
- (4-5) ハロゲン原子を有することのあるアルコキシカルボニル基
- (4-6) 水酸基置換低級アルキル基
- (4-7) ピリジン環上に置換基としてピロリル基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基
- (4-8) ピリジン環上に置換基として低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジル基
- (4-9) ピリジル低級アルキル基

- (4-10) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子；ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基；フェノキシ基；ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基；低級アルキルチオ基；低級アルキルスルホニル基；低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基；ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基；ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル基；低級アルケニル基；アミノスルホニル基；水酸基；低級アルキル基を有することのあるカルバモイル基；フェニル低級アルコキシ基及びシアノ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル基
- (4-11) シクロアルキル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるシクロアルキル基
- (4-12) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子；フェノキシ基；フェニル基；ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基；低級アルコキシ基；低級アルカノイル基；ニトロ基；シアノ基；低級アルキル基及びフェニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基；ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基；ピロリル基；ピラゾリル基；1, 2, 4-トリアゾリル基及びイミダゾリル基なる群から選ばれた基を有することのあるベンゾイル基
- (4-13) フェニル環上に低級アルキレンジオキシ基を有するベンゾイル基
- (4-14) シクロアルキルカルボニル基
- (4-15) フリルカルボニル基
- (4-16) ナフチルカルボニル基
- (4-17) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、低級アルキル基、ハロゲン原子及びニトロ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェノキシカルボニル基
- (4-18) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子及びニトロ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシカルボニル基
- (4-19) ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基（フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい）及びフェニル基（フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい）なる群から選ばれた基を有することのあるピペリジニル基
- (4-20) テトラヒドロピラニル低級アルキル基
- (4-21) シクロアルキル低級アルキル基
- (4-22) 低級アルケニル基
- (4-23) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び水酸基なる群から選ばれた基を有することがあり、低級アルキル基上に低級アルコキシカルボニル基を有することのあるフェニル低級アルキル基
- (4-24) 低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル低級アルキル基
- (4-25) フリル低級アルキル基
- (4-26) 低級アルキル基及びフェニル基（フェニル環上に低級アルキル基が置換していてもよい）なる群から選ばれた基を有することのあるカルバモイル低級アルキル基
- (4-27) 低級アルコキシ低級アルキル基
- (4-28) 低級アルキル基上にカルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基なる群から選ばれた基を有することのあるイミダゾリル低級アルキル基
- (4-29) 低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基
- (4-30) 2, 3, 4, 5-テトラヒドロフラン環上に置換基としてオキソ基を有することのある2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル基
- (4-31) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基
- (4-32) ピロリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピロリジニル低級アルキル基
- (4-33) フェノキシ低級アルカノイル基
- (4-34) モルホリノ低級アルキル基

- (4-35) インドリル基
- (4-36) チアゾリル基
- (4-37) 1, 2, 4-トリアゾリル基
- (4-38) ピリジル低級アルカノイル基
- (4-39) チエニルカルボニル基
- (4-40) チエニル低級アルカノイル基
- (4-41) シクロアルキル低級アルカノイル基
- (4-42) イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリルカルボニル基
- (4-43) ピラジルカルボニル基
- (4-44) ピペリジン環上に置換基としてベンゾイル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニルカルボニル基
- (4-45) クロマニルカルボニル基
- (4-46) イソインドリン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるイソインドリニル低級アルカノイル基
- (4-47) チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基及びチオオキソ基なる群より選ばれた基を有することのあるチアゾリジニル低級アルカノイル基
- (4-48) ピペリジニル低級アルカノイル基
- (4-49) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニルカルボニル基
- (4-50) フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル低級アルケニルカルボニル基
- (4-51) ピリジル低級アルケニルカルボニル基
- (4-52) ピリジルチオ低級アルカノイル基
- (4-53) インドリルカルボニル基
- (4-54) ピロリルカルボニル基
- (4-55) ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニルカルボニル基
- (4-56) ベンゾフリルカルボニル基
- (4-57) インドリル低級アルカノイル基
- (4-58) ベンゾチエニルカルボニル基
- (4-59) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルカノイル基
- (4-60) フェニル環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、水酸基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、ハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及びハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニルスルホニル基
- (4-61) チオフェン環上に置換基としてハロゲン原子及び低級アルコキシカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるチエニルスルホニル基
- (4-62) キノリルスルホニル基
- (4-63) イミダゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイミダゾリルスルホニル基
- (4-64) フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有するフェニルスルホニル基
- (4-65) 低級アルケニルスルホニル基
- (4-66) シクロアルキル低級アルキルスルホニル基
- (4-67) 3, 4-ジヒドロー-2H-1, 4-ベンゾキサジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのある3, 4-ジヒドロー-2H-1, 4-ベンゾキサジニルスルホニル基

(4-68) ピラゾール環上に置換基としてハロゲン原子及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピラゾリルスルホニル基

(4-69) イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリルスルホニル基

(4-70) チアゾール環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるチアゾリルスルホニル基、

(4-71) フェニル低級アルキルスルホニル基

(4-72) フェニル低級アルケニルスルホニル基

(4-73) ナフチルオキシカルボニル基

(4-74) 低級アルキニルオキシカルボニル基

(4-75) 低級アルケニルオキシカルボニル基

(4-76) フェニル低級アルコキシ置換低級アルコキシカルボニル基

(4-77) シクロアルキル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるシクロアルキルオキシカルボニル基

(4-78) テトラゾリル基

(4-79) イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリル基；

R⁶及びR⁷は、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環、1，2，3，4-テトラヒドロイソキノリル基又はイソインドリニル基を形成してもよい。

該複素環上には、下記(5-1)～(5-28)で示される基なる群から選ばれた少なくとも1種の置換基が1～3個置換していてもよい。

(5-1) 低級アルキル基

(5-2) 低級アルコキシ基

(5-3) オキソ基

(5-4) 水酸基

(5-5) ピリジル低級アルキル基

(5-6) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、シアノ基及び水酸基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル基

(5-7) 低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル低級アルキル基

(5-8) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルキル基

(5-9) ピリミジル基

(5-10) ピラジル基

(5-11) シクロアルキル基

(5-12) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルコキシ基

(5-13) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基

(5-14) 低級アルキレンジオキシ基を有するベンゾイル基

(5-15) 低級アルキル基及びフェニル基なる群から選ばれた基を有することのあるカルバモイル低級アルキル基

(5-16) ベンゾオキサゾリル基

(5-17) 低級アルコキシカルボニル基

(5-18) カルバモイル基

(5-19) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルキリデン基

(5-20) フェニル低級アルコキシカルボニル基

(5-21) ピリジン環上に置換基としてシアノ基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピリジル基

(5-22) フリル低級アルキル基

(5-23) テトラヒドロピラニル基

(5-24) イミダゾリル低級アルキル基

(5-25) ナフチル基

(5-26) 2, 3-ジヒドロー-1H-インデニル基

(5-27) 1, 3-ジオキソラニル低級アルキル基

(5-28) 基- $(A_3)_n N R^{11} R^{12}$;

A_1 は、低級アルキレン基を示す。

R^8 及び R^9 は、各々下記(6-1)～(6-4)で示されるいずれかの基を示す。

(6-1) 水素原子、

(6-2) 低級アルキル基、

(6-3) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を有することのあるフェニル基

(6-4) シクロアルキル基；

R^8 及び R^9 は、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して5又は6員の飽和複素環を形成してもよい。

A_2 は、低級アルキレン基を示す。

R^{10} は、下記(7-1)～(7-41)で示されるいずれかの基を示す。

(7-1) 水素原子

(7-2) 低級アルキル基

(7-3) ハロゲン原子を有することのあるアルコキシカルボニル基

(7-4) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、フェニル基、ハロゲン原子、シアノ基、フェノキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ピラゾリル基及びハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるベンゾイル基

(7-5) アルカノイル基

(7-6) フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基

(7-7) シクロアルキル低級アルカノイル基

(7-8) フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基

(7-9) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基

(7-10) フェニル低級アルケニルカルボニル基

(7-11) ピリジン環上に置換基としてハロゲン原子及びハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基

(7-12) フリルカルボニル基

(7-13) チエニルカルボニル基

(7-14) ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるピペリジニルカルボニル基

(7-15) ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニルカルボニル基

(7-16) テトラヒドロピラニルカルボニル基

(7-17) ナフチルカルボニル基

(7-18) インドリルカルボニル基

(7-19) ベンゾフリルカルボニル基

(7-20) ベンゾチオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾチエニルカルボニル基

(7-21) フリル低級アルキル基

(7-22) ピリジン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基を有することのあるピリジル低級アルキル基

(7-23) チオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるチエニル低級アルキル基

(7-24) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基；シアノ基；ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基；低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基；ハロゲン原子；低級アルコキシカルボニル基；低級アルカノイルオキシ基；低級アルキルスルホニル基；低級アルキルチオ基及びピロリジニル基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基

(7-25) チアゾリル低級アルキル基

(7-26) イミダゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイミダゾリル低級アルキル基

(7-27) ピロール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピロリル低級アルキル基

(7-28) シクロアルキル低級アルキル基

(7-29) 低級アルキルチオ低級アルキル基

(7-30) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェノキシカルボニル基

(7-31) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルコキシカルボニル基

(7-32) ナフチルオキシカルボニル基

(7-33) 低級アルキニルオキシカルボニル基

(7-34) シクロアルキルカルボニル基

(7-35) キノキサリニルカルボニル基

(7-36) 基-CO-NR¹³R¹⁴

(7-37) ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル基、

(7-38) シクロアルキル基

(7-39) テトラヒドロピラニル基

(7-40) 低級アルコキシ低級アルキル基

(7-41) テトラヒドロ-2H-チオピラニル基；

A₃は、低級アルキレン基を示す。

mは、0又は1を示す。

R¹¹及びR¹²は、各々下記(8-1)～(8-5)で示されるいずれかの基を示す。

(8-1) 水素原子

(8-2) 低級アルキル基

(8-3) 低級アルカノイル基

(8-4) フェニル低級アルカノイル基；

(8-5) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル基

R¹¹及びR¹²は、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して5又は6員の飽和複素環を形成してもよい。

該複素環上には、下記(9-1)及び(9-2)で示される基なる群から選ばれた少なくとも1種の置換基が1～3個置換していてもよい。

(9-1) 低級アルキル基

(9-2) フェニル基；

R¹³及びR¹⁴は、各々下記(10-1)～(10-3)で示されるいずれかの基を示す。

(10-1) 水素原子

(10-2) 低級アルキル基

(10-3) フェニル基；

R¹³及びR¹⁴は、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して5又は6員の飽和複素環を形成してもよい。]

で表されるカルボスチリル誘導体又はその塩。

【請求項2】

TFF2を選択的に產生誘導する化合物を含有する、消化管疾患、口腔疾患、上気道疾患、気道疾患、眼疾患、癌又は創傷の予防及び治療剤。

【請求項3】

TFF2を選択的に產生誘導する化合物が、 10^{-5} M以下のTFF2產生誘導有効濃度を有している、請求項2記載の予防及び治療剤。

【書類名】明細書

【発明の名称】カルボスチリル誘導体

【技術分野】

【0001】

本発明は、カルボスチリル誘導体に関する。

【背景技術】

【0002】

トレフォイルファクターファミリー (Trefoil factors, TFFs) は、6個のシステム残基により三つ葉のクローバー様構造を有する非常に安定なペプチドである。これまでヒトで3種類 (TFF1, TFF2及びTFF3) のペプチドが同定されている。これらは、消化管をはじめ粘液と関連した組織に分布しており、主に粘液産生細胞によって分泌されている。また、傷害粘膜周囲や再生腺管等で発現亢進がみられる。TFFsの生理的意義はほとんど解明されていないが、主な機能としては細胞の遊走作用 (motogenic effect) 、細胞保護作用、抗アポトーシス作用等が報告されている（非特許文献1）。

【0003】

TFF2はブタ脾臓から発見された106アミノ酸残基を有するペプチドであり、正常では、胃粘膜の頸細胞、胃幽門部、潰瘍辺縁粘膜及び再生粘膜、被覆粘液層及びブルンネル腺等に豊富に含有されている。

【0004】

TFF2は、ラットにおける実験において、胃潰瘍及び大腸炎の発症阻止や治癒促進作用を有していることが報告されている（非特許文献2、非特許文献3、非特許文献4、非特許文献5、非特許文献6、非特許文献7等参照）。

【0005】

TFF2のノックアウトマウスを用いた実験では、インドメタシン潰瘍が増悪化すること等が報告されている（非特許文献8）。

【0006】

非特許文献9は、TFF2が粘液の安定化作用を有していることを開示している。

【0007】

更に、非特許文献10は、TFF2が気道上皮傷害の修復に関連している可能性を報告している。

【0008】

以上のことから、TFF2は、粘膜傷害の保護及び修復に大きな役割を演じていることが考えられ、内因性のTFF2産生を亢進させることは、TFF2による治療効果が期待される疾患に対して有効であると考えられる。

【0009】

以上の他、非特許文献11は、TFF3が、制癌剤等によって惹起される口内炎をはじめ消化管全体の粘膜炎に対して有効であること、非特許文献12及び非特許文献13は、TFF1のノックアウトマウスで胃癌が発生したことから、TFF1が癌抑制遺伝子であることを開示している。そして、非特許文献14及び非特許文献15は、TFF2もこれらTFF1及びTFF3が有している作用と類似の作用を有しているであろうことを報告している。

【0010】

今日までに、TFF2を産生誘導 (up-regulation) する物質として、PPAR γ (peroxisome proliferator-activated receptor- γ) のリガンド活性を有する化合物（インドメタシン、アスピリン、プロスタグランジンJ2及びトログリタゾンが知られている（非特許文献16、非特許文献17及び非特許文献18）。

【0011】

しかしながら、これらの化合物は、種々の欠点を有している。

【0012】

トログリタゾンに関しては、大腸炎モデルにおいて大腸組織内のTFF2含量は増加し

なかつたという報告がある（非特許文献19）。

【0013】

インドメタシン及びアスピリンは、シクロオキシゲナーゼ活性を阻害することによるプロスタグランジン産生の低下あるいは直接的粘膜傷害作用により、動物及びヒトにおいて消化管粘膜傷害を誘発することはよく知られている。

【0014】

以上のことからこれらの物質に関しては、TFF2 産生誘導作用による薬理効果発現は、in vivoにおいては発揮されにくくと推察される。

【0015】

蛋白質ではケラチノサイト成長因子（Keratinocyte growth factor、KGF）が、ラット下部消化管でTFF2 及びTFF3 の発現を増加することが報告されている（非特許文献20）。しかしながら、KGFは、細胞増殖因子であること及び経口投与が困難であることから、臨床での使用に制限がある。

【0016】

また、TFFペプタイド自身の薬理活性及び臨床応用の可能性を示唆した報告はいくつある（特許文献1、特許文献2、特許文献3等）が、効果発現のために生理的濃度より大量に投与する必要があることから、臨床での応用は極めて困難である。

【0017】

以上の理由により、TFFペプタイドは、現在までに治療薬として適用されるには至っていないのが現状である。

【特許文献1】WO9214837

【特許文献2】WO02102403

【特許文献3】WO0246226

【非特許文献1】Mol. Cell Biol. 4: 721-732, 2003

【非特許文献2】Gastroenterology 108: 108-116, 1995

【非特許文献3】Gastroenterology 110: 489-497, 1996

【非特許文献4】Alim. Pharmacol. Ther. 14: 1033-1040, 2000

【非特許文献5】Gut 45: 516-522, 1999

【非特許文献6】Gut 44: 636-642, 1999

【非特許文献7】J. Leukoc. Biol. 75: 214-223, 2004

【非特許文献8】J. Clin. Invest. 109: 193-204, 2002

【非特許文献9】Eur. J. Clin. Invest. 32: 519-527, 2002

【非特許文献10】Am. J. Respir. Cell Mol. Biol. 29: 458-464, 2003

【非特許文献11】Gastroenterology 126: 796-808, 2004

【非特許文献12】Science 274: 259-262, 1996

【非特許文献13】Gastroenterology 119: 691-698, 2000

【非特許文献14】Mol. Cell Biol. 4: 721-732, 2003

【非特許文献15】Int. J. Mol. Med. 12: 3-9, 2003

【非特許文献16】FEBS Lett. 488: 206-210, 2001

【非特許文献17】Alim. Pharmacol. Ther. 18 (suppl. 1): 119-125, 2003

【非特許文献18】FEBS Lett. 558: 33-38, 2004

【非特許文献19】Can. Res. 61: 2424-2428, 2001

【非特許文献20】Am. J. Physiol. 284: R564-R573, 2002

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0018】

本発明は、TFF2 を選択的に産生誘導する新規な化合物を提供すること、及びTFF2 の産生を誘導することにより、消化管疾患、口腔疾患、上気道疾患、気道疾患、眼疾患、癌又は創傷の予防及び治療剤を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

【0019】

内因性のTFF2を選択的に產生誘導し得る新規な化合物を開発すべく銳意研究を重ねてきた。その結果、下記一般式(1)で表されるカルボスチリル誘導体が、内因性のTFF2を選択的に產生誘導し得ることを見い出した。本発明は、斯かる知見に基づき完成されたものである。

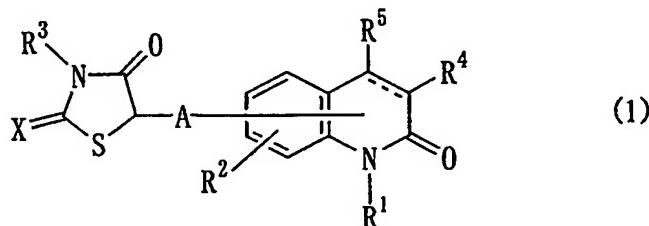
【0020】

本発明は、下記1～3に示す発明を提供する。

1. 一般式(1)

【0021】

【化1】



【0022】

[式中、Aは、直接結合、低級アルキレン基又は低級アルキリデン基を示す。

Xは、酸素原子又は硫黄原子を示す。

R⁴及びR⁵は、それぞれ水素原子を示す。

カルボスチリル骨格の3、4位の結合は一重結合又は二重結合を示す。

カルボスチリル骨格の3、4位の結合が二重結合を示す場合、R⁴及びR⁵は互いに結合して基—CH=CH—CH=CH—を形成してもよい。

R¹は、下記(1-1)～(1-17)で示されるいずれかの基を示す。

(1-1) 水素原子

(1-2) 低級アルキル基

(1-3) フェニル環上に置換基としてフェニル基、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、基—(B)₁NR⁶R⁷、ニトロ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、フェニル低級アルコキシ基、フェノキシ基、ピペリジニル低級アルコキシカルボニル基、シクロアルキル基を有することのあるアミノ低級アルコキシカルボニル基、2-イミダゾリン環上に置換基として低級アルキルチオ基を有することのある2-イミダゾリニルカルボニル基、3-ピロリン環上に置換基として低級アルキル基を有することのある3-ピロリニルカルボニル基、チアゾリジニルカルボニル基、3-アザビシクロ[3.2.2]ノニルカルボニル基及びピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニルカルボニル基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基

(1-4) シクロアルキル低級アルキル基

(1-5) フェノキシ低級アルキル基

(1-6) ナフチル低級アルキル基

(1-7) 低級アルコキシ低級アルキル基

(1-8) カルボキシ低級アルキル基

(1-9) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基

(1-10) ピリジン環上に置換基としてハロゲン原子；ピペリジニル基；モルホリノ基；ピペラジン環上に置換基としてフェニル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペラジニル基；チエニル基；フェニル基；ピリジル基及びアミノ基上に低級アルキル基を有することのあるアニリノ基なる群から選ばれた基を有することのあるピリジル低級アルキル基

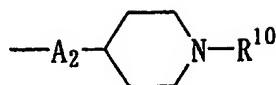
(1-11) シアノ低級アルキル基

(1-12) 基—A₁—CONR⁸R⁹

(1-13) 基

【0023】

【化2】



【0024】

(1-14) フェニル基

(1-15) キノリル低級アルキル基

(1-16) 低級アルコキシ低級アルコキシ置換低級アルキル基

(1-17) 水酸基置換低級アルキル基；

 R^2 は、下記(2-1)～(2-33)で示されるいずれかの基を示す。

(2-1) 水素原子

(2-2) 低級アルコキシ基

(2-3) 低級アルキル基

(2-4) カルボキシ低級アルコキシ基

(2-5) 低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基

(2-6) 水酸基

(2-7) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子を有することのある低級アルキルチオ基、低級アルコキシ基、ニトロ基、低級アルキルスルホニル基、低級アルコキシカルボニル基、フェニル低級アルケニル基、低級アルカノイルオキシ基及び1, 2, 3-チオジアゾリル基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基

(2-8) ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル低級アルコキシ基

(2-9) 低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基

(2-10) 低級アルケニルオキシ基

(2-11) ピリジン環上に置換基としてハロゲン原子置換もしくは非置換の低級アルキル基を有することのあるピリジル低級アルコキシ基

(2-12) 低級アルキニルオキシ基

(2-13) フェニル低級アルキニルオキシ基

(2-14) フェニル低級アルケニルオキシ基

(2-15) フラン環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基を有することのあるフリル低級アルコキシ基

(2-16) テトラゾール環上に置換基としてフェニル低級アルキル基、フェニル基及びシクロアルキル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるテトラゾリル低級アルコキシ基

(2-17) 1, 2, 4-オキサジアゾール環上に置換基としてフェニル基（フェニル環上に低級アルキル基が置換していてもよい）を有することのある1, 2, 4-オキサジアゾリル低級アルコキシ基

(2-18) イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリル低級アルコキシ基

(2-19) 1, 3, 4-オキサジアゾール環上に置換基としてフェニル基（フェニル環上に低級アルキル基が置換していてもよい）を有することのある1, 3, 4-オキサジアゾリル低級アルコキシ基

(2-20) 低級アルカノイル低級アルコキシ基

(2-21) チアゾール環上に置換基としてフェニル基（フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい）及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるチアゾリル低級アルコキシ基

(2-22) ピペリジン環上に置換基としてベンゾイル基（フェニル環上にハロゲン原子が置

換していてもよい) を有することのあるピペリジニルオキシ基

- (2-23) チエニル低級アルコキシ基
- (2-24) フェニルチオ低級アルコキシ基
- (2-25) 低級アルキル基を有することのあるカルバモイル置換低級アルコキシ基
- (2-26) ベンゾイル低級アルコキシ基
- (2-27) ピリジルカルボニル低級アルコキシ基
- (2-28) イミダゾール環上に置換基としてフェニル低級アルキル基を有することのあるイミダゾリル低級アルコキシ基
- (2-29) フエノキシ低級アルコキシ基
- (2-30) フェニル低級アルコキシ置換低級アルコキシ基
- (2-31) 2, 3-ジヒドロー-1H-インデニルオキシ基
- (2-32) イソインドリン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるイソインドリニル低級アルコキシ基
- (2-33) フエニル基；

R^3 は、下記(3-1)～(3-19)で示されるいずれかの基を示す。

(3-1) 水素原子

(3-2) 低級アルキル基

(3-3) 水酸基置換低級アルキル基

(3-4) シクロアルキル低級アルキル基

(3-5) カルボキシ低級アルキル基

(3-6) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基

(3-7) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル基、低級アルコキシカルボニル基、フェノキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルホニル基、フェニル低級アルコキシ基及び低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基

(3-8) ナフチル低級アルキル基

(3-9) フラン環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基を有することのあるフリル低級アルキル基

(3-10) チアゾール環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキル基(低級アルキル基上にハロゲン原子が置換していてもよい)を有することのあるフェニル基なる群から選ばれた基を有することのあるチアゾリル低級アルキル基

(3-11) テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル低級アルキル基

(3-12) ベンゾチオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾチエニル低級アルキル基

(3-13) 低級アルキニル基

(3-14) 低級アルケニル基

(3-15) フェニル低級アルケニル基

(3-16) ベンゾイミダゾリル低級アルキル基

(3-17) ピリジル低級アルキル基

(3-18) イミダゾール環上に置換基としてフェニル低級アルキル基を有することのあるイミダゾリル低級アルキル基

(3-19) キノリル低級アルキル基；

Bは、カルボニル基又は基-NHCO-を示す。

1は、0又は1を示す。

R^6 及び R^7 は、各々下記(4-1)～(4-79)で示されるいずれかの基を示す。

(4-1) 水素原子

(4-2) 低級アルキル基

(4-3) 低級アルカノイル基

- (4-4) ハロゲン原子を有することのある低級アルキルスルホニル基
- (4-5) ハロゲン原子を有することのあるアルコキシカルボニル基
- (4-6) 水酸基置換低級アルキル基
- (4-7) ピリジン環上に置換基としてピロリル基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基
- (4-8) ピリジン環上に置換基として低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジル基
- (4-9) ピリジル低級アルキル基
- (4-10) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子；ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基；フェノキシ基；ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基；低級アルキルチオ基；低級アルキルスルホニル基；低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基；ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基；ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル基；低級アルケニル基；アミノスルホニル基；水酸基；低級アルキル基を有することのあるカルバモイル基；フェニル低級アルコキシ基及びシアノ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル基
- (4-11) シクロアルキル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるシクロアルキル基
- (4-12) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子；フェノキシ基；フェニル基；ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基；低級アルコキシ基；低級アルカノイル基；ニトロ基；シアノ基；低級アルキル基及びフェニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基；ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基；ピロリル基；ピラゾリル基；1, 2, 4-トリアゾリル基及びイミダゾリル基なる群から選ばれた基を有することのあるベンゾイル基
- (4-13) フェニル環上に低級アルキレンジオキシ基を有するベンゾイル基
- (4-14) シクロアルキルカルボニル基
- (4-15) フリルカルボニル基
- (4-16) ナフチルカルボニル基
- (4-17) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、低級アルキル基、ハロゲン原子及びニトロ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェノキシカルボニル基
- (4-18) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子及びニトロ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシカルボニル基
- (4-19) ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイール基（フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい）及びフェニル基（フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい）なる群から選ばれた基を有することのあるピペリジニル基
- (4-20) テトラヒドロピラニル低級アルキル基
- (4-21) シクロアルキル低級アルキル基
- (4-22) 低級アルケニル基
- (4-23) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び水酸基なる群から選ばれた基を有することがあり、低級アルキル基上に低級アルコキシカルボニル基を有することのあるフェニル低級アルキル基
- (4-24) 低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル低級アルキル基
- (4-25) フリル低級アルキル基
- (4-26) 低級アルキル基及びフェニル基（フェニル環上に低級アルキル基が置換していてもよい）なる群から選ばれた基を有することのあるカルバモイル低級アルキル基
- (4-27) 低級アルコキシ低級アルキル基
- (4-28) 低級アルキル基上にカルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基なる群から選ばれた基を有することのあるイミダゾリル低級アルキル基

- (4-29) 低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基
- (4-30) 2, 3, 4, 5-テトラヒドロフラン環上に置換基としてオキソ基を有することのある2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル基
- (4-31) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基
- (4-32) ピロリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピロリジニル低級アルキル基
- (4-33) フェノキシ低級アルカノイル基
- (4-34) モルホリノ低級アルキル基
- (4-35) インドリル基
- (4-36) チアゾリル基
- (4-37) 1, 2, 4-トリアゾリル基
- (4-38) ピリジル低級アルカノイル基
- (4-39) チエニルカルボニル基
- (4-40) チエニル低級アルカノイル基
- (4-41) シクロアルキル低級アルカノイル基
- (4-42) イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリルカルボニル基
- (4-43) ピラジルカルボニル基
- (4-44) ピペリジン環上に置換基としてベンゾイル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニルカルボニル基
- (4-45) クロマニルカルボニル基
- (4-46) イソインドリン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるイソインドリニル低級アルカノイル基
- (4-47) チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基及びチオオキソ基なる群より選ばれた基を有することのあるチアゾリジニル低級アルカノイル基
- (4-48) ピペリジニル低級アルカノイル基
- (4-49) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニルカルボニル基
- (4-50) フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル低級アルケニルカルボニル基
- (4-51) ピリジル低級アルケニルカルボニル基
- (4-52) ピリジルチオ低級アルカノイル基
- (4-53) インドリルカルボニル基
- (4-54) ピロリルカルボニル基
- (4-55) ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニルカルボニル基
- (4-56) ベンゾフリルカルボニル基
- (4-57) インドリル低級アルカノイル基
- (4-58) ベンゾチエニルカルボニル基
- (4-59) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルカノイル基
- (4-60) フェニル環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、水酸基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、ハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及びハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニルスルホニル基
- (4-61) チオフェン環上に置換基としてハロゲン原子及び低級アルコキシカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるチエニルスルホニル基
- (4-62) キノリルスルホニル基
- (4-63) イミダゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイミダゾリ

ルスルホニル基

(4-64) フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有するフェニルスルホニル基

(4-65) 低級アルケニルスルホニル基

(4-66) シクロアルキル低級アルキルスルホニル基

(4-67) 3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのある3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニルスルホニル基

(4-68) ピラゾール環上に置換基としてハロゲン原子及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピラゾリルスルホニル基

(4-69) イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリルスルホニル基

(4-70) チアゾール環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるチアゾリルスルホニル基、

(4-71) フェニル低級アルキルスルホニル基

(4-72) フェニル低級アルケニルスルホニル基

(4-73) ナフチルオキシカルボニル基

(4-74) 低級アルキニルオキシカルボニル基

(4-75) 低級アルケニルオキシカルボニル基

(4-76) フェニル低級アルコキシ置換低級アルコキシカルボニル基

(4-77) シクロアルキル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるシクロアルキルオキシカルボニル基

(4-78) テトラゾリル基

(4-79) イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリル基；

R⁶及びR⁷は、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基又はイソインドリニル基を形成してもよい。

該複素環上には、下記(5-1)～(5-28)で示される基なる群から選ばれた少なくとも1種の置換基が1～3個置換していてもよい。

(5-1) 低級アルキル基

(5-2) 低級アルコキシ基

(5-3) オキソ基

(5-4) 水酸基

(5-5) ピリジル低級アルキル基

(5-6) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、シアノ基及び水酸基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル基

(5-7) 低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル低級アルキル基

(5-8) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルキル基

(5-9) ピリミジル基

(5-10) ピラジル基

(5-11) シクロアルキル基

(5-12) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルコキシ基

(5-13) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基

(5-14) 低級アルキレンジオキシ基を有するベンゾイル基

(5-15) 低級アルキル基及びフェニル基なる群から選ばれた基を有することのあるカルバモイル低級アルキル基

- (5-16) ベンゾオキサゾリル基
- (5-17) 低級アルコキシカルボニル基
- (5-18) カルバモイル基
- (5-19) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルキリデン基
- (5-20) フェニル低級アルコキシカルボニル基
- (5-21) ピリジン環上に置換基としてシアノ基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピリジル基
- (5-22) フリル低級アルキル基
- (5-23) テトラヒドロピラニル基
- (5-24) イミダゾリル低級アルキル基
- (5-25) ナフチル基
- (5-26) 2, 3-ジヒドロー-1H-インデニル基
- (5-27) 1, 3-ジオキソラニル低級アルキル基
- (5-28) 基- $(A_3)_m N R^{11} R^{12}$;
A₁は、低級アルキレン基を示す。
R⁸及びR⁹は、各々下記(6-1)～(6-4)で示されるいずれかの基を示す。
- (6-1) 水素原子、
- (6-2) 低級アルキル基、
- (6-3) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を有することのあるフェニル基
- (6-4) シクロアルキル基；
R⁸及びR⁹は、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して5又は6員の飽和複素環を形成してもよい。
A₂は、低級アルキレン基を示す。
R¹⁰は、下記(7-1)～(7-41)で示されるいずれかの基を示す。
- (7-1) 水素原子
- (7-2) 低級アルキル基
- (7-3) ハロゲン原子を有することのあるアルコキシカルボニル基
- (7-4) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、フェニル基、ハロゲン原子、シアノ基、フェノキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ピラゾリル基及びハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるベンゾイル基
- (7-5) アルカノイル基
- (7-6) フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基
- (7-7) シクロアルキル低級アルカノイル基
- (7-8) フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニル基
- (7-9) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基
- (7-10) フェニル低級アルケニルカルボニル基
- (7-11) ピリジン環上に置換基としてハロゲン原子及びハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基
- (7-12) フリルカルボニル基
- (7-13) チエニルカルボニル基
- (7-14) ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるピペリジニルカルボニル基
- (7-15) ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニルカルボニル基
- (7-16) テトラヒドロピラニルカルボニル基

- (7-17) ナフチルカルボニル基
- (7-18) インドリルカルボニル基
- (7-19) ベンゾフリルカルボニル基
- (7-20) ベンゾチオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾチエニルカルボニル基
- (7-21) フリル低級アルキル基
- (7-22) ピリジン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基を有することのあるピリジル低級アルキル基
- (7-23) チオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるチエニル低級アルキル基
- (7-24) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基；シアノ基；ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基；低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基；ハロゲン原子；低級アルコキシカルボニル基；低級アルカノイルオキシ基；低級アルキルスルホニル基；低級アルキルチオ基及びピロリジニル基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基
- (7-25) チアゾリル低級アルキル基
- (7-26) イミダゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイミダゾリル低級アルキル基
- (7-27) ピロール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピロリル低級アルキル基
- (7-28) シクロアルキル低級アルキル基
- (7-29) 低級アルキルチオ低級アルキル基
- (7-30) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェノキシカルボニル基
- (7-31) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルコキシカルボニル基
- (7-32) ナフチルオキシカルボニル基
- (7-33) 低級アルキニルオキシカルボニル基
- (7-34) シクロアルキルカルボニル基
- (7-35) キノキサリニルカルボニル基
- (7-36) 基-CO-NR¹³R¹⁴
- (7-37) ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル基、
- (7-38) シクロアルキル基
- (7-39) テトラヒドロピラニル基
- (7-40) 低級アルコキシ低級アルキル基
- (7-41) テトラヒドロー-2H-チオピラニル基；
A₃は、低級アルキレン基を示す。

mは、0又は1を示す。

R¹¹及びR¹²は、各々下記(8-1)～(8-5)で示されるいずれかの基を示す。

- (8-1) 水素原子
- (8-2) 低級アルキル基
- (8-3) 低級アルカノイル基
- (8-4) フェニル低級アルカノイル基；

(8-5) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル基

R¹¹及びR¹²は、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して5又は6員の飽和複素環を形成してもよい。

該複素環上には、下記(9-1)及び(9-2)で示される基なる群から選ばれた少なくとも1種の置換基が1～3個置換していてもよい。

(9-1) 低級アルキル基

(9-2) フェニル基；

R¹³及びR¹⁴は、各々下記(10-1)～(10-3)で示されるいずれかの基を示す。

(10-1) 水素原子

(10-2) 低級アルキル基

(10-3) フェニル基；

R¹³及びR¹⁴は、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して5又は6員の飽和複素環を形成してもよい。] で表されるカルボスチリル誘導体又はその塩。

2. TFF2を選択的に產生誘導する化合物を含有する、消化管疾患、口腔疾患、上気道疾患、気道疾患、眼疾患、癌又は創傷の予防及び治療剤。

3. TFF2を選択的に產生誘導する化合物が、10⁻⁵M以下のTFF2產生誘導有効濃度を有している、上記2記載の予防及び治療剤。

【0025】

上記一般式(1)において示される各基は、より具体的にはそれぞれ次の通りである。

【0026】

低級アルキレン基としては、例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、2-メチルトリメチレン、2,2-ジメチルエチレン、2,2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキレン基を例示できる。

【0027】

低級アルキリデン基としては、例えば、メチリデン、エチリデン、プロピリデン、ブチリデン、ペンチリデン、ヘキシリデン等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキリデン基を例示できる。

【0028】

低級アルキル基としては、炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基であって、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、n-ヘキシル、イソヘキシル、3-メチルペンチル基等を挙げることができる。

【0029】

低級アルコキシ基としては、炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルコキシ基であって、例えば、メトキシ、エトキシ、n-ブロポキシ、イソブロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、tert-ブトキシ、sec-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、ネオペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、イソヘキシルオキシ、3-メチルペンチルオキシ基等を挙げることができる。

【0030】

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子を示す。

【0031】

低級アルコキシカルボニル基としては、アルコキシ部分の炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルコキシカルボニル基であって、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-ブロポキシカルボニル、イソブロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、sec-ブトキシカルボニル、n-ペンチルオキシカルボニル、イソペンチルオキシカルボニル、ネオペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシカルボニル、イソヘキシルオキシカルボニル、3-メチルペンチルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0032】

フェニル低級アルコキシ基としては、例えば、ベンジルオキシ、2-フェニルエトキシ、1-フェニルエトキシ、3-フェニルプロポキシ、4-フェニルブトキシ、5-フェニルペンチルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-フェニルエト

キシ、2-メチル-3-フェニルプロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基を挙げることができる。

【0033】

ピペリジニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば、[(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニル]メトキシカルボニル、2-[(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニル]エトキシカルボニル、1-[(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニル]エトキシカルボニル、3-[(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニル]プロポキシカルボニル、4-[(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニル]ブトキシカルボニル、5-[(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニル]ペンチルオキシカルボニル、6-[(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニル]ヘキシルオキシカルボニル、1,1-ジメチル-2-[(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニル]エトキシカルボニル、2-メチル-3-[(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニル]プロポキシカルボニル基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるピペリジニルアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0034】

シクロアルキル基としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル基等の炭素数3～8のシクロアルキル基を挙げることができる。

【0035】

シクロアルキル基を有することのあるアミノ低級アルコキシカルボニル基としては、例えば、アミノメトキシカルボニル、2-アミノエトキシカルボニル、シクロプロピルアミノメトキシカルボニル、2-シクロヘキシルアミノエトキシカルボニル、1-シクロブチルアミノエトキシカルボニル、3-シクロペンチルアミノプロポキシカルボニル、4-シクロヘプチルアミノブトキシカルボニル、5-シクロオクチルアミノペンチルオキシカルボニル、6-シクロヘキシルアミノヘキシルオキシカルボニル、1,1-ジメチル-2-シクロヘキシルアミノエトキシカルボニル、2-メチル-3-シクロプロピルアミノプロポキシカルボニル、2-(N-シクロプロピル-N-シクロヘキシルアミノ)エトキシカルボニル基等の炭素数3～8のシクロアルキル基を1～2個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアミノ置換アルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0036】

低級アルキルチオ基としては、例えば、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、tert-ブチルチオ、n-ペンチルチオ、n-ヘキシルチオ基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基を挙げることができる。

【0037】

2-イミダゾリン環上に置換基として低級アルキルチオ基を有することのある2-イミダゾリニルカルボニル基としては、例えば、(1-、2-、4-又は5-)2-イミダゾリジニルカルボニル、2-メチルチオ-(1-、4-又は5-)2-イミダゾリジニルカルボニル、2-エチルチオ-(1-、4-又は5-)2-イミダゾリジニルカルボニル、4-プロピルチオ-(1-、2-又は5-)2-イミダゾリジニルカルボニル、5-イソプロピルチオ-(1-、2-又は4-)2-イミダゾリジニルカルボニル、2-n-ブチルチオ-(1-、4-又は5-)2-イミダゾリジニルカルボニル、2-n-ペンチルチオ-(1-、4-又は5-)2-イミダゾリジニルカルボニル、2-n-ヘキシルチオ-(1-、4-又は5-)2-イミダゾリジニルカルボニル、2,4-ジメチルチオ-(1-又は5-)2-イミダゾリジニルカルボニル基等の2-イミダゾリン環上に置換基として低級アルキルチオ基を1～3個有することのある2-イミダゾリニルカルボニル基を挙げることができる。

【0038】

3-ピロリン環上に置換基として低級アルキル基を有することのある3-ピロリニルカルボニル基としては、例えば、(1-、2-又は3-)3-ピロリニルカルボニル、2-メチル-(1-、2-、3-、4-又は5-)3-ピロリニルカルボニル、2-エチル-(1-、2-、3-、4-又は5-)3-ピロリニルカルボニル、3-プロピル-(1-、2-、4-又は5-)3-ピロリニルカルボニル、4-イソプロピル-(1-、2-、3-又は5-)3-ピロリニルカルボニル、5-n-ブチル-(1-、2-、3-、4-又は5-)3-ピロリニルカルボニル、2-n-ペンチル-(1-、2-、3-、4-又は5-)3-ピロリニルカルボニル、2-n-ヘキシル-(1-、2-、3-、4-又は5-)3-ピロリニルカルボニル、2,5-ジメチル-(1-、2-、3-、4-又は5-)3-ピロリニルカルボニル、2,4-ジメチル-(1-、2-、3-又は5-)3-ピロリニルカルボニル、2,3-ジメチル-(1-、2-、4-又は5-)3-ピロリニルカルボニル、2,4,5-トリメチルチオ-(1-、2-、3-又は5-)3-ピロリニルカルボニル基等の3-ピロリン環上に置換基として低級アルキル基を1~3個有することのある3-ピロリニルカルボニル基を挙げることができる。

【0039】

ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニルカルボニル基としては、例えば、(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1-メチル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1-エチル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1-n-ブロピル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1-n-ブチル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1-n-ヘキシル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1,2-ジメチル-(3-、4-、5-又は6-)ピペリジニルカルボニル、1,2,3-トリメチル-(4-、5-又は6-)ピペリジニルカルボニル、2-n-ブロピル-(1-、3-、4-、5-又は6-)ピペリジニルカルボニル、3-エチル-(1-、2-、4-、5-又は6-)ピペリジニルカルボニル、2-メチル-4-イソプロピル-(1-、3-、5-又は6-)ピペリジニルカルボニル、1-メチル-(2-、3-、4-、5-又は6-)ピペリジニルカルボニル基等のピペリジン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基を1~3個有することのあるピペリジニルカルボニル基を例示できる。

【0040】

フェニル環上に置換基としてフェニル基、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、基-(B)₁NR⁶R⁷、ニトロ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、フェニル低級アルコキシ基、フェノキシ基、ピペリジニル低級アルコキシカルボニル基、シクロアルキル基を有することのあるアミノ低級アルコキシカルボニル基、2-イミダゾリン環上に置換基として低級アルキルチオ基を有することのある2-イミダゾリニルカルボニル基、3-ピロリン環上に置換基として低級アルキル基を有することのある3-ピロリニルカルボニル基、チアゾリジニルカルボニル基、3-アザビシクロ[3.2.2]ノニルカルボニル基及びピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニルカルボニル基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、例えば、ベンジル、1-フェネチル、2-フェネチル、3-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル、1,1-ジメチル-2-フェニルエチル、1,1-ジフェニルメチル、2,2-ジフェニルエチル、3,3-ジフェニルプロピル、1,2-ジフェニルエチル、4-[N-(3-ピリジル)アミノカルボニル]ベンジル、4-[N-(2-メトキシフェニル)アミノカルボニル]ベンジル、4-[2-(2-ピペリジニル)エトキシカルボニル]ベンジル、4-[2-(シクロヘキシルアミノ)エトキシカルボニル]ベンジル、4-[4-(3-ピリジルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル]ベンジル、4-[4-(4-ピリジルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル]ベンジル、4-[4-(2-ピリジルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル]ベンジル、4-[4-(2-ピリジル)-1-ピペラジ

ニルカルボニル] ベンジル、4-[4-(3-クロロフェニル)-1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4-[4-(2-フルオロフェニル)-1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4-[4-(2-ピリミジル)-1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4-(4-シクロペンチル-1-ピペラジニルカルボニル) ベンジル、4-[4-(2-メトキシフェニル)-1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4-[4-(4-フルオロフェニル)-1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4-[4-(3,4-メチレンジオキシベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4-(N-シクロヘキシリ-N-メチルアミノカルボニル) ベンジル、4-[N,N-ジ-n-ブチルアミノカルボニル] ベンジル、4-[4-(1-ペペリジニル)-1-ピペリジニルカルボニル] ベンジル、4-(1-ホモピペリジニルカルボニル) ベンジル、4-[2-メチルチオ-1-(2-イミダゾリニル)カルボニル] ベンジル、4-{N-[2-(2-ピリジル)エチル]-N-メチルアミノカルボニル} ベンジル、4-[N-(1-メチル-4-ピペリジニル)-N-メチルアミノカルボニル] ベンジル、4-(N,N-ジイソブチルアミノカルボニル) ベンジル、4-[N-(2-テトラヒドロピラニル)メチル-N-エチルアミノカルボニル] ベンジル、4-(4-チオモルホリノカルボニル) ベンジル、4-[2,5-ジメチル-1-(3-ピロニル)カルボニル] ベンジル、4-(3-チアゾリジニルカルボニル) ベンジル、4-(N-シクロプロピルメチル-N-n-プロピルアミノカルボニル) ベンジル、4-[1-(3-アザビシクロ[3.2.2]ノニルカルボニル) ベンジル、4-(N-シクロペンチル-N-アリルアミノカルボニル) ベンジル、4-[4-(4-ピリジル)-1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4-[4-(2-フェニルエチル)-1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4-[4-(2-ピラジル)-1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4-(N-n-ブチルアミノカルボニル) ベンジル、4-[N-(1-メチル-1-フェニルエチル)アミノカルボニル] ベンジル、4-(N-ベンジルアミノカルボニル) ベンジル、4-[N-(2-クロロベンジル)アミノカルボニル] ベンジル、4-[N-(3-クロロベンジル)アミノカルボニル] ベンジル、4-[N-(4-クロロベンジル)アミノカルボニル] ベンジル、4-[N-(2-ピリジル)メチルアミノカルボニル] ベンジル、4-[N-(3-ピリジル)メチルアミノカルボニル] ベンジル、4-[4-(4-ピリジル)メチルアミノカルボニル] ベンジル、4-[3,5-ジメチル-1-ピペリジニルカルボニル] ベンジル、4-[N-(2-フリル)メチルアミノカルボニル] ベンジル、4-[4-(2-フルオロベンジルオキシ)-1-ピペリジニルカルボニル] ベンジル、4-[{4-[N-(2-フェニルアセチル)-N-メチルアミノ]-1-ピペリジニルカルボニル}] ベンジル、4-[{(4-メトキシ-1-ピペリジニル)カルボニル}] ベンジル、4-[{(4-(3,4-ジメチル-1-ピペラジニル)-1-ピペリジニル)カルボニル}] ベンジル、4-[{(4-(4-クロロベンゾイル)-1-ピペリジニル)カルボニル}] ベンジル、4-[{(4-(4-メトキシフェニル)-1-ピペリジニル)カルボニル}] ベンジル、4-[{(4-(2-ベンゾオキサゾリル)-1-ピペラジニル)カルボニル}] ベンジル、4-[{(4-アニリノカルボニルメチル-1-ピペラジニル)カルボニル}] ベンジル、4-[{(4-メチル-2-ベンジル-1-ピペラジニル)カルボニル}] ベンジル、4-[{(4-フェニル-3-オキソ-1-ピペラジニル)カルボニル}] ベンジル、4-[{(4-tetra-3-オキソ-1-ピペラジニル)カルボニル}] ベンジル、4-[N-(1-ベンゾイル-4-ピペリジニル)-N-メチルアミノカルボニル] ベンジル、4-[N-(1-アセチル-4-ピペリジニル)-N-メチルアミノカルボニル] ベンジル、4-[{4-(4-シアノフェニル)-1-ピペラジニル}カルボニル] ベンジル、4-[N-メチルカルバモイルメチル-N-ベンジルアミノカルボニル] ベンジル、4-[N-ベンジル-N-シクロヘキシルアミノカルボニル] ベンジル、4-[2-(

N-メチル-N-フェニルカルバモイル) エチル-N-メチルアミノカルボニル] ベンジル、4- { [4- (3-フェニル-1-ピロリジニル) -1-ピペリジニル] カルボニル} ベンジル、4- [(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル] ベンジル、4- [(4-ベンジル-1-ピペリジニル) カルボニル] ベンジル、4- {[4- (3, 4-メチレンジオキシベンゾイル) -1-ピペラジニル] カルボニル} ベンジル、4- [N-メチル-N- (4-メチルベンジル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N-メチル-N- (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N-メチル-N- (2-メトキシベンジル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [(4-フェニル-1-ピペラジニル) カルボニル] ベンジル、4- [(4-フェニル-4-ヒドロキシ-1-ピペリジニル) カルボニル] ベンジル、4- (N-イソプロピル-N-ベンジルアミノカルボニル) ベンジル、4- (N-エチル-N-シクロヘキシリルアミノカルボニル) ベンジル、4- [N-エチル-N- (4-ピリジル) メチルアミノカルボニル] ベンジル、4- (N-n-プロピルアミノカルボニル) ベンジル、4- [N-エチル-N- (4-エトキシベンジル) アミノカルボニル] ベンジル、4- (N-エチル-N-シクロヘキシリルメチルアミノカルボニル) ベンジル、4- [N- (2-エトキシリル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [{4- [N-メチル-N- (4-クロロフェニル) アミノ] -1-ピペリジニル} カルボニル] ベンジル、4- [N- (1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [{4- [N- (1-メチル-1-シクロヘキシリル) アミノカルボニル] ベンジル、4- {N- [2- (3-メトキシフェニル) エチル] アミノカルボニル} ベンジル、4- [N- (4-トリフルオロメトキシベンジル) アミノカルボニル] ベンジル、4- {N- [2- (4-クロロフェニル) エチル] アミノカルボニル} ベンジル、4- [N- (1-メチル-1-シクロヘキシリル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミノカルボニル] ベンジル、4- (N-シクロヘキシリルメチルアミノカルボニル) ベンジル、4- [N- (4-フルオロベンジル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (1-フェニルエチル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (3-フェニルプロピル) アミノカルボニル] ベンジル、4- {N- [3- (1-イミダゾリル) プロピル] アミノカルボニル} ベンジル、4- [N- (2-フェニルエチル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [2- (N, N-ジイソプロピルアミノ) エチルアミノカルボニル] ベンジル、4- {N- [1-メトキシカルボニル-2- (4-ヒドロキシフェニル) エチル] アミノカルボニル} ベンジル、4- [N- (カルバモイルメチル) アミノカルボニル] ベンジル、4- {N- [1-カルバモイル-2- (5-イミダゾリル) エチル] アミノカルボニル} ベンジル、4- {N- [1-メトキシカルボニル-2- (5-イミダゾリル) エチル] アミノカルボニル} ベンジル、4- [N- (2-オキソ-2, 3, 4, 5-テトラヒドロフラン-3-イル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [(2-エトキシカルボニル-1-ピペリジニル) カルボニル] ベンジル、4- [(2-カルバモイル-1-ピロリジニル) カルボニル] ベンジル、4- {[N- (2, 6-ジメチルベンジル) -N-エチル] アミノカルボニル} ベンジル、4- {[N- [(4-メチルフェニル) カルバモイルメチル] -N-メチルアミノカルボニル} ベンジル、4- [N- (4-クロロベンジル) -N-エチルアミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (4-トリフルオロメチルベンジル) -N-エチルアミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (3-プロモベンジル) -N-エチルアミノカルボニル] ベンジル、4- {[4- (2-クロロベンジル) -1-ピペリジニル] カルボニル} ベンジル、4- {[4- (3-クロロベンジル) -1-ピペリジニル] カルボニル} ベンジル、4- {[4- (2-クロロベンジリデン) -1-ピペリジニル] カルボニル} ベンジル、4- [N- (2-メトキシベンジル) アミノカルボニル] ベンジル、4- {N- [2- (2-フルオロフェニル) エチル] アミノカルボニル} ベンジル、4- {N- [2- (3-フルオロフェニル) エチル] アミノカルボニル} ベンジル、4- [(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) カルボニル] ベンジル、4- {[4- (3-シアノ-2-ピリジル) -1-ピペラジニル] カルボニル} ベンジル、4- [(4-フェニル-1-

一ピペリジニル) カルボニル] ベンジル、4- [{4- [(3-フリル) メチル] -1- ピペラジニル] カルボニル] ベンジル、4- | [4- (3-ピリジル) -1-ピペラジニル] カルボニル] ベンジル、4- | [4- (4-テトラヒドロピラニル) -1-ピペラジニル] カルボニル] ベンジル、4- | [4- (2-フルオロベンジル) -1-ピペリジニル] カルボニル] ベンジル、4- | [4- (4-モルホリノ) -1-ピペリジニル] カルボニル] ベンジル、4- [4- [2- (1, 3-ジオキソラン-2-イル) エチル] -1-ピペラジニル] カルボニル] ベンジル、4-フェニルベンジル、2-フェニルベンジル、3-フェニルベンジル、4-tert-ブチルベンジル、4-アミノベンジル、4-ニトロベンジル、4-メトキシカルボニルベンジル、4-カルボキシベンジル、3-メトキシ-4-クロロベンジル、4-メトキシベンジル、2, 4, 6-トリメトキシベンジル、3, 4-ジクロロベンジル、4-クロロベンジル、4-プロモベンジル、2, 4, 6-トリフルオロベンジル、4-フルオロベンジル、4-シアノベンジル、4-ピペリジニルカルボニルベンジル、4-アニリノカルボニルベンジル、4- (N-シクロヘキシルアミノカルボニル) ベンジル、4- (N-ベンゾイルアミノ) ベンジル、4- (N-シクロヘキシルアミノ) ベンジル、4-フェニルカルバモイルアミノベンジル、4-メチルベンジル、3, 4-ジメチルベンジル、3, 4, 5-トリメチルベンジル、4-ベンジルオキシベンジル、4-エチルカルバモイルアミノベンジル、4-エチルアミノカルボニルベンジル、4-イソプロピルアミノカルボニルベンジル、4- [N- (2-ヒドロキシエチル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (3-ピリジル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (4-クロロフェニル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (4-イソプロピルフェニル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (4-フェノキシフェニル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (3-フェノキシフェニル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (3-フェノキシベンゾイル) アミノ] ベンジル、4- [N- (4-フェノキシベンゾイル) アミノ] ベンジル、4- [N- (4-クロロベンゾイル) アミノ] ベンジル、4- [N- (2, 6-ジクロロベンゾイル) アミノ] ベンジル、4- [N- (4-メトキシフェニル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- (2-フリルカルボニル) アミノ] ベンジル、4- [N- (4-メトキシベンゾイル) アミノ] ベンジル、4- [N- (3-メトキシベンゾイル) アミノ] ベンジル、4- [N- (2-メトキシベンゾイル) アミノ] ベンジル、4-フェノキシベンジル、4-n-ペンチルオキシカルボニルアミノベンジル、4- [N- (4-メトキシフェノキシカルボニル) アミノ] ベンジル、4-ベンジルオキシカルボニルアミノベンジル、4-エタノイルアミノベンジル、4- (N-アセチルアミノ) ベンジル、4-メチルスルホニルアミノベンジル、メトキシカルボニルアミノベンジル、4- [N- (4-イソプロピルフェニル) アミノカルボニル] ベンジル、4- [4- {2- [(1-, 2-又は3-) イミダゾリル] エチル} -1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4- {4- [3-メチル-(2-, 3-又は4-) ピリジル] -1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4- {4- [4-メチル-(2-, 3-又は4-) ピリジル] -1-ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4- {4- [(1-又は2-) ナフチル] - (1-, 2-又は3-) ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4- (1, 2-, 3-又は4-ピペラジニルカルボニル) ベンジル、4- [2-メチル-(1-, 3-, 4-, 5-又は6-) ピペリジニルカルボニル] ベンジル、4- [3-エトキシカルボニル-(1-, 2-, 4-, 5-又は6-) ピペリジニル] ベンジル、4- [4- (3-ヒドロキシフェニル) -(1-, 2-, 4-, 5-又は6-) ピペリジニル] ベンジル、4- [4-ヒドロキシ-4-ベンジル-(1-, 2-又は3-) ピペリジニルカルボニル] ベンジル、4- [3-アセチルアミノ-(1-, 2-, 4-又は5-) ピロリジニルカルボニル] ベンジル、4- [N- {2- [1-エチル-(2-又は3-) ピロリジニル] エチル} アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- {2- [(2-又は3-) ピロリジニル] エチル} アミノカルボニル] ベンジル、4- [N- {2-

([2-、3-又は4-] モルホリノ) エチル] アミノカルボニル] ベンジル、4-[N- {3- ([2-、3-又は4-] モルホリノ) プロピル] アミノカルボニル] ベンジル、4-[2, 6-ジメチル- (3-、4-又は5-) モルホリノカルボニル] ベンジル、4-[4-(4-トリフルオロメチルアニリノ)- (1-、2-、又は3-) ピペラジニルカルボニル] ベンジル、4-{2- [(1-、2-、3-又は4-) ピペリジニルメチル]- (3-、4-、5-又は6-) モルホリノカルボニル] ベンジル、4-{4- [(1-、2-、4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル]- (1-、2-又は3-) ピペリジニルカルボニル] ベンジル、4-[N-(2-メチルシクロヘキシル) アミノカルボニル] ベンジル、4-イソインドリニルカルボニルベンジル、4-[2-フェニル- (1-、3-、4-又は5-) ピロリジニルカルボニル] ベンジル、4-{2- [(1-、2-、3-又は4-) モルホリノメチル]- (1-、3-、4-又は5-) ピロリジニルカルボニル] ベンジル、4-[2-ジメチルアミノメチル- (1-、3-、4-又は5-) ピロリジニルカルボニル] ベンジル、4-{N-[1-(4-フルオロベンゾイル)- (2-、3-又は4-) ピペリジニル]- N-メチルアミノカルボニル] ベンジル、4-[2-フェニル- (3-、4-又は5-) チアゾリジニルカルボニル] ベンジル、4-[N-メチル- (2-メトキシアニリノ) カルボニル] ベンジル、4-(3-メチルチオアニリノカルボニル) ベンジル、4-(2-メチルチオアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3, 4-ジクロロアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-トリフルオロメトキシ-4-アニリノカルボニル) ベンジル、4-アニリノカルボニルベンジル、4-(4-クロロアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-メトキシアニリノカルボニル) ベンジル、4-(2-クロロアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-メチルアニリノカルボニル) ベンジル、4-(2, 4-ジメトキシアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-メトキシ-5-クロロアニリノカルボニル) ベンジル、4-(2-メトキシ-5-アセチルアミノアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3, 4-ジメトキシアニリノカルボニル) ベンジル、4-[2- (1-メチルアリル) アニリノカルボニル] ベンジル、4-(3-トリフルオロメトキシアニリノカルボニル) ベンジル、4-(2-メチルアニリノカルボニル) ベンジル、4-(2-フルオロアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3-フルオロアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-フルオロアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3-ジメチルアミノアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-エトキシアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3-トリフルオロメチルアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3-アセチルアミノアニリノカルボニル) ベンジル、4-[(2-、3-又は4-) ピリジルアミノカルボニル] ベンジル、4-[N-メチル- (3-メチルアニリノ) カルボニル] ベンジル、4-[3-メトキシ- (2-、4-、5-又は6-) ピリジルアミノカルボニル] ベンジル、4-(2-フェノキシアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3-フェノキシアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-フェノキシアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3, 5-ジクロロアニリノカルボニル) ベンジル、4-(2, 4-ジメチルアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3, 5-ジメチルアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3, 5-ジフルオロアニリノカルボニル) ベンジル、4-[(1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-) インドリルアミノカルボニル] ベンジル、4-(3-フルオロ-4-メトキシアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-アミノスルホニルアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-メチル-3-メトキシアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3-クロロ-4-メチルアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3-メトキシ-5-トリフルオロメチルアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3-クロロ-4-フルオロアニリノカルボニル) ベンジル、4-[3-メチル- (2-、4-、5-又は6-) ピリジルアミノカルボニル] ベンジル、4-[(2-、4-又は5-) チアゾリルアミノカルボニル] ベンジル、4-(3-クロロ-4-ヒドロキ

シアニリノカルボニル) ベンジル、4-(2-クロロ-5-アセチルアミノアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-メチルチオアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-イソプロピルアニリノカルボニル) ベンジル、4-[4-tert-ブチルアニリノカルボニル) ベンジル、4-[2-又は4]-1,2,4-トリアゾリルアミノカルボニル] ベンジル、4-[4-[2-オキソ-(1-、3-、4-又は5-) ピロリジニル] アニリノカルボニル] ベンジル、4-(4-メチルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(4-メチルカルバモイルアニリノカルボニル) ベンジル、アニリノカルボニルベンジル、4-(2-ベンジルオキシアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-ビニルアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-アセチルアミノアニリノカルボニル) ベンジル、4-(3-アセチルアミノアニリノカルボニル) ベンジル、4-(4-トリフルオロメチルアニリノカルボニル) ベンジル、4-[3-[2-、3-又は4-) ピリジル] プロピオニルアミノ] ベンジル、4-(3-フェノキシプロピオニルアミノ) ベンジル、4-[2-[2-、3-又は4-) ピリジルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-[2-又は3-) フリルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-又は3-) チエニルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-[1-、2-又は3-) ピロリル] -(3-、4-、5-又は6-) ピリジルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-[2-又は3-) チエニル] アセチルアミノ] ベンジル、4-[2-[1-、2-又は3-) ピペリジルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[1-ベンゾイル-(2-、3-又4-) ピペリジニルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[1-アセチル-(2-、3-又4-) ピペリジニルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) クロマニル] ベンジル、4-(2-ニトロベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(3-ニトロベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(4-ニトロベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(2-フェニルベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(2-ジメチルアミノベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(2-アニリノベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(2-ジクロロベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(2-シアノベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(3-フェノキシベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(2-フェノキシベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(4-フェノキシベンゾイルアミノ) ベンジル、4-[1-又は2-) ナフチルカルボニルアミノ] ベンジル、4-(2-メチル-3-フルオロベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(3,4-メチレンジオキシベンゾイルアミノ) ベンジル、4-[2-[1,3-ジオキソ-(2-、4-又は5-) イソインドリニル] アセチルアミノ] ベンジル、4-[2-[2-チオオキソ-4-オキソチアゾリジニル] アセチルアミノ] ベンジル、4-[3-[1-、2-、3-又は4-) ピペリジニル] プロピオニルアミノ] ベンジル、4-(4-アセチルベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(2-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(3-トリフルオロメチルベンゾイル
アミノ) ベンジル、4-(4-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ) ベンジル、4-[2-(2-クロロフェニル) アセチルアミノ] ベンジル、4-(2-クロロ-4-フルオロベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(2-クロロシンナモイルアミノ) ベンジル、4-(3,4-メチレンジオキシシンナモイルアミノ) ベンジル、4-[3-(2-、3-又は4-) ピリジルビニルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-クロロ-(3-、4-、5-又は6-) ピリジルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-[2-、3-又は4-) ピリジルチオ] アセチルアミノ] ベンジル、4-[2-(2-、3-、4-、5-、6-又は7-) インドリルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[1-(1-、2-又は3-) ピロリルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-オキソ-(1-、3-、4-又は5-) ピロリジニルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-(2-、3-、4-、5-、6-又は7-) ベンゾフリルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-(2-、3-、4-又は5-) ピリジルカルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-(1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-) インドリル] アセチルアミノ] ベンジル、4-[2-

3-、4-、5-、6-又は7-) ベンゾチエニルカルボニルアミノ] ベンジル、4- {
 4- [2-オキソ- (1-、3-、4-又は5-) ピロリジニル] ベンゾイルアミノ} ベ
 ンジル、4- {4- [(1-、2-又は3-) ピロリル] ベンゾイルアミノ} ベンジル、
 4- {4- [(1-、3-、4-又は5-) ピラゾリル] ベンゾイルアミノ} ベンジル、
 4- {4- [(1-、3-又は5-) 1, 2, 4-トリアゾリル] ベンゾイルアミノ} ベ
 ンジル、4- {4- [(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] ベンゾイルアミノ}
 ベンジル、4- [4- (3, 5-ジメチル-4-イソオキサゾリル) ベンゾイルアミノ]
 ベンジル、4- [(2-又は3-) ピラジルカルボニルアミノ] ベンジル、4- (2-メ
 トキシベンゾイルアミノ) ベンジル、4- (2-メトキシ-5-クロロベンゾイルアミノ
) ベンジル、4- (4-クロロベンゾイルアミノ) ベンジル、4- (2-フェノキシアセ
 チルアミノ) ベンジル、4- (3-フェニルプロピオニル) ベンジル、4- [(2-、3
 -又は4-) ピリジルカルボニルアミノ] ベンジル、4-ベンゾイルアミノベンジル、4
 -シンナモイルアミノベンジル、4- (4-メトキシフェニルスルホニルアミノ) ベンジ
 ル、4- (3-メトキシフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2-メトキシフェ
 ニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (4-クロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジ
 ル、4- (3-クロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2-クロロフェニル
 スルホニルアミノ) ベンジル、4- (2-メチルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、
 4- (3-メチルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (4-メチルフェニルスル
 ホニルアミノ) ベンジル、4- (4-フルオロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4
 - (3-フルオロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2-フルオロフェニルス
 ルホニルアミノ) ベンジル、4- (2-メトキシ-5-クロロフェニルスルホニルアミノ
) ベンジル、4- (2-トリフルオロメチルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-
 (3-トリフルオロメチルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (4-トリフルオ
 ロメチルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- [(2-又は3-) チエニルスルホ
 ニルアミノ] ベンジル、4- (2-クロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-
 (2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (3-トリフルオ
 ロメトキシフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (4-トリフルオロメトキシフェ
 ニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2-メトキシカルボニルフェニルスルホニルア
 ミノ) ベンジル、4- (2-シアノフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (3-シ
 アノフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (4-シアノフェニルスルホニルアミノ
) ベンジル、4- (3, 4-ジメトキシフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2
 , 5-ジメトキシフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2-ニトロフェニルスル
 ホニルアミノ) ベンジル、4- (3-ニトロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-
 (4-ニトロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (4-プロモフェニルスルホニ
 ルアミノ) ベンジル、4- (3-ブロモフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2
 -ブロモフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (4-n-ブチルフェニルスルホニ
 ルアミノ) ベンジル、4- (2-メトキシ-5-クロロフェニルスルホニルアミノ) ベン
 ジル、4- (2, 6-ジクロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- [(1-、2
 -、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) キノリルスルホニルアミノ] ベンジル、4
 - [1-メチル- (2-、4-又は5-) イミダゾリルスルホニルアミノ] ベンジル、4
 - (2, 3-ジクロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2, 5-ジクロロフ
 ェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2, 4-ジクロロフェニルスルホニルアミノ
) ベンジル、4- (3-ニトロ-4-メチルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-
 (2-クロロ-4-フルオロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2, 4-ジク
 ロロ-5-メチルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2-メチル-5-ニトロ
 フェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (2-クロロ-5-ニトロフェニルスルホニ
 ルアミノ) ベンジル、4- (2-クロロ-4-シアノフェニルスルホニルアミノ) ベンジ
 ル、4- (2, 4, 6-トリメチルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (4-ア
 セチルアミノフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (3, 5-ジクロロ-2-ヒド
 ロキシフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4- (4-メトキシ-2-ニトロフェニル

スルホニルアミノ) ベンジル、4-(3,4-ジクロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(4-カルボキシフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(2-ブロモ-5-クロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(4-エチルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(2,5-ジメチルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(2,5-ジフルオロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(2-クロロ-4-アセチルアミノフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(2-メトキシ-4-メチルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(2-メチル-3-クロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(2,6-ジフルオロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(2-メチル-5-フルオロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(3-メチル-4-クロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(4-イソプロピルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(3,4-ジクロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(2-フルオロー-4-ブロモフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(4-メチル-3-クロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-ビニルスルホニルアミノベンジル、4-(3-クロロプロピルフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-シクロヘキシルメチルスルホニルアミノベンジル、4-[2-クロロ-(3-,4-又は5-) チエニルスルホニルアミノ] ベンジル、4-(3,5-ジクロロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-[2-(4-メトキシカルボニル) エチル] フェニルスルホニルアミノ} ベンジル、4-[4-メチル-(2-,3-,4-,5-,6-,7-又は8-) 3,4-ジヒドロ-2H-1,4-ジヒドロ-2H-1,4-ベンゾオキサジニルスルホニルアミノ] ベンジル、4-(2,2,2-トリフルオロエチルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(2,3,5-トリメチル-4-メトキシフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-[(1,3-ジメチル-5-クロロ-4-ピラゾリル) スルホニルアミノ] ベンジル、4-[(3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリル) スルホニルアミノ] ベンジル、4-(3-カルボキシ-4-ヒドロキシフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-[[2,3-ジクロロ-(4-又は5-) チエニル] スルホニルアミノ] ベンジル、4-[[2,5-ジクロロ-(3-又は4-) チエニル] スルホニルアミノ] ベンジル、4-[[2-ブロモ-(3-,4-又は5-) チエニル] スルホニルアミノ] ベンジル、4-(4-カルボキシフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-(2-アセチルアミノ-4-メチル-5-チアゾリルスルホニルアミノ) ベンジル、4-[[2-メトキシカルボニル-(3-,4-又は5-) チエニル] スルホニルアミノ] ベンジル、4-ベンジルスルホニルアミノベンジル、4-スチルスルホニルアミノベンジル、4-(2,4,5-トリフルオロフェニルスルホニルアミノ) ベンジル、4-フェニルスルホニルアミノベンジル、4-フェノキシカルボニルアミノベンジル、4-[(4-クロロフェノキシ) カルボニルアミノ] ベンジル、4-[(4-ブロモフェノキシ) カルボニルアミノ] ベンジル、4-ベンジルオキシカルボニルアミノベンジル、4-メトキシカルボニルアミノベンジル、4-n-ブトキシカルボニルアミノベンジル、4-[(4-メトキシフェノキシ) カルボニルアミノ] ベンジル、4-[(3-メトキシフェノキシ) カルボニルアミノ] ベンジル、4-[(2-メトキシフェノキシ) カルボニルアミノ] ベンジル、4-[(1-又は2-) ナフチルオキシカルボニルアミノ] ベンジル、4-[(4-フルオロフェノキシ) カルボニルアミノ] ベンジル、4-[(4-メチルフェノキシ) カルボニルアミノ] ベンジル、4-[(2-クロロベンジルオキシ) カルボニルアミノ] ベンジル、4-[2-プロピニルオキシカルボニルアミノ] ベンジル、4-[(4-ニトロフェノキシ) カルボニルアミノ] ベンジル、4-(2-フルオロエトキシカルボニルアミノ) ベンジル、4-(3-ブテニルオキシカルボニルアミノ) ベンジル、4-(4-クロロブトキシカルボニルアミノ) ベンジル、4-(2-クロロエトキシカルボニルアミノ) ベンジル、4-[2-(ベンジルオキシ) エトキシカルボニルアミノ] ベンジル、4-ブロボキシカルボニルアミノベンジル、4-n-ブ

トキシカルボニルアミノベンジル、4-(2-イソプロピル-5-メチルシクロヘキシリオキシカルボニルアミノ)ベンジル、4-[(4-ニトロベンジルオキシ)カルボニルアミノ]ベンジル、4-(2-エチルヘキシリオキシカルボニルアミノ)ベンジル、4-[N-メチル-(4-クロロアニリノ)カルボニル]ベンジル、4-[(2-クロロアニリノ)カルボニル]ベンジル、4-[(3-シアノアニリノ)カルボニル]ベンジル、4-[(4-シアノアニリノ)カルボニル]ベンジル、4-[(2-シアノアニリノ)カルボニル]ベンジル、4-[(2-クロロ-4-フルオロアニリノ)カルボニル]ベンジル、4-[(1-又は5-)テトラゾリルアミノカルボニル]ベンジル、4-[5-メチル-(3-又は4-)イソオキサゾリルアミノカルボニル]ベンジル、4-[4-メチル-(1-、2-、3-又は4-)ピペラジニル]アニリノカルボニル]ベンジル基等のフェニル環上に置換基としてフェニル基、前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分子鎖状アルキル基、前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分子鎖状アルコキシ基、ハロゲン原子、後記例示の基-(B)₁N R⁶ R⁷、ニトロ基、カルボキシ基、前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分子鎖状アルコキシカルボニル基、シアノ基、前記例示のアルコキシ部分の炭素数1~6の直鎖又は分子鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基、フェノキシ基、前記例示のアルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分子鎖状アルコキシ基であるピペリジニルアルコキシカルボニル基、前記例示の炭素数3~8のシクロアルキル基を1~2個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分子鎖状アルコキシ基であるアミノアルコキシカルボニル基、前記例示の2-イミダゾリン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分子鎖状アルキルチオ基を1~3個有することのある2-イミダゾリニルカルボニル基、前記例示の3-ピロリン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分子鎖状アルキル基を1~3個有することのある3-ピロリニルカルボニル基、チアゾリジニルカルボニル基、3-アザビシクロ[3.2.2]ノニルカルボニル基及び前記例示のピペリジン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分子鎖状アルキル基を1~3個有することのあるピペリジニルカルボニル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるフェニルを1~2個有する炭素数1~6の直鎖又は分子鎖状アルキル基を例示できる。

【0041】

シクロアルキル低級アルキル基としては、例えば、シクロプロピルメチル、シクロヘキシリメチル、2-シクロプロピルエチル、1-シクロブチルエチル、シクロペンチルメチル、3-シクロペンチルプロピル、4-シクロヘキシリブチル、5-シクロヘプチルペンチル、6-シクロオクチルヘキシリル、1,1-ジメチル-2-シクロヘキシリルエチル、2-メチル-3-シクロプロピルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である炭素数3~8のシクロアルキルアルキル基を挙げができる。

【0042】

フェノキシ低級アルキル基としては、例えば、フェノキシメチル、2-フェノキシエチル、1-フェノキシエチル、3-フェノキシプロピル、4-フェノキシブチル、1,1-ジメチル-2-フェノキシエチル、5-フェノキシペンチル、6-フェノキシヘキシリル、1-フェノキシイソプロピル、2-メチル-3-フェノキシプロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェノキシアルキル基を例示できる。

【0043】

ナフチル低級アルキル基としては、例えば、(1又は2-)ナフチルメチル、2-[(1又は2-)ナフチル]エチル、1-[(1又は2-)ナフチル]エチル、3-[(1又は2-)ナフチル]プロピル、4-[(1又は2-)ナフチル]ブチル、5-[(1又は2-)ナフチル]ペンチル、6-[(1又は2-)ナフチル]ヘキシリル、1,1-ジメチル-2-[(1又は2-)ナフチル]エチル、2-メチル-3-[(1又は2-)ナフチル]プロピル基等のアルキル部分の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるナフチルアルキル基を例示できる。

低級アルコキシ低級アルキル基としては、例えば、メトキシメチル、2-メトキシエチル、1-エトキシエチル、2-エトキシエチル、3-n-ブトキシプロピル、4-n-ブロポキシプロピル、1-メチル-3-イソブトキシプロピル、1,1-ジメチル-2-n-ペンチルオキシエチル、5-n-ヘキシルオキシペンチル、6-メトキシヘキシル、1-エトキシイソプロピル、2-メチル-3-メトキシプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、アルコキシ部分の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアルコキシアルキル基を例示できる。

【0044】

カルボキシ低級アルキル基としては、例えば、カルボキシメチル、2-カルボキシエチル、1-カルボキシエチル、3-カルボキシプロピル、4-カルボキシプロピル、5-カルボキシペンチル、6-カルボキシヘキシル、1,1-ジメチル-2-カルボキシエチル、2-メチル-3-カルボキシプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるカルボキシアルキル基を例示できる。

【0045】

低級アルコキシカルボニル低級アルキル基としては、例えば、メトキシカルボニル-メチル、エトキシカルボニルメチル、2-メトキシカルボニルエチル、2-エトキシカルボニルエチル、1-エトキシカルボニルエチル、3-メトキシカルボニルプロピル、3-エトキシカルボニルプロピル、4-エトキシカルボニルブチル、5-イソプロポキシカルボニルペンチル、6-n-ブロポキシカルボニルヘキシル、1,1-ジメチル-2-n-ブトキシカルボニルエチル、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニルプロピル、2-n-ペンチルオキシカルボニルエチル、n-ヘキシルオキシカルボニルメチル基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるアルコキシカルボニルアルキル基を例示できる。

【0046】

ピペラジン環上に置換基としてフェニル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペラジニル基としては、例えば、(1-又は2-)ピペラジニル、4-メチル-(1-、2-又は3-)ピペラジニル、4-エチル-(1-、2-又は3-)ピペラジニル、4-tert-ブチル-(1-、2-又は3-)ピペラジニル、4-n-ブロピル-(1-、2-又は3-)ピペラジニル、4-sec-ブチル-(1-、2-又は3-)ピペラジニル、4-n-ブチル-(1-、2-又は3-)ピペラジニル、4-n-ヘキシル-(1-、2-又は3-)ピペラジニル、3,4-ジメチル-(1-、2-、5-又6-)ピペラジニル、3,4,5-トリメチル-(1-又は2-)ピペラジニル、4-フェニル-(1-、2-又は3-)ピペラジニル、2,4-ジフェニル-(1-、3-、5-又6-)ピペラジニル、4-フェニル-2-メチル-(1-、3-、5-又6-)ピペラジニル基等のピペラジン環上に置換基としてフェニル基及び炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群から選ばれた基を1～3個有することのあるピペラジニル基を例示できる。

【0047】

アミノ基上に低級アルキル基を有することのあるアニリノ基としては、アニリノ、N-メチルアニリノ、N-エチルアニリノ、N-n-ブロピルアニリノ、N-イソプロピルアニリノ、N-n-ブチルアニリノ、N-sec-ブチルアニリノ、N-tert-ブチルアニリノ、N-n-ペンチルアニリノ、N-n-ヘキシルアニリノ基等のアミノ基上に炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を有することのあるアニリノ基を例示できる。

【0048】

ピリジン環上に置換基としてハロゲン原子；ピペリジニル基；モルホリノ基；ピペラジン環上に置換基としてフェニル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペラジニル基；チエニル基；フェニル基；ピリジル基及びアミノ基上に低級アルキル基を有することのあるアニリノ基なる群から選ばれた基を有することのあるピリジル

低級アルキル基としては、例えば、(2-、3-又は4-)ピリジルメチル、2-[(2-、3-又は4-)ピリジル]エチル、1-[(2-、3-又は4-)ピリジル]エチル、3-[(2-、3-又は4-)ピリジル]プロピル、4-[(2-、3-又は4-)ピリジル]ブチル、1,1-ジメチル-2-[(2-、3-又は4-)ピリジル]エチル、5-[(2-、3-又は4-)ピリジル]ペンチル、6-[(2-、3-又は4-)ピリジル]ヘキシル、1-[(2-、3-又は4-)ピリジル]イソプロピル、2-メチル-3-[(2-、3-又は4-)ピリジル]プロピル、(2-クロロ-3-ピリジル)メチル、[2-クロロ-(3-,4-,5-又は6-)ピリジル]メチル、[2,3-ジクロロ-(4-,5-又は6-)ピリジル]メチル、[2-ブロモ-(3-,4-,5-又は6-)ピリジル]メチル、[2,4,6-トリフルオロー-(3-,5-又は6-)ピリジル]メチル、[2-(1-ピペリジニル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]メチル、[2-(4-モルホリノ)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]メチル、[2-(4-メチル-1-ピペラジニル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]メチル、2-[2-(4-エチル-1-ピペラジニル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]エチル、3-[2-(4-イソプロピル-1-ピペラジニル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]プロピル、4-[2-(4-s e c-ブチル-1-ピペラジニル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]ブチル、5-[2-(4-n-ペンチル-1-ピペラジニル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]ペンチル、6-[2-(4-n-ヘキシル-1-ピペラジニル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]ヘキシル、[2-(4-フェニル-2-メチル-1-ピペラジニル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]メチル、[2-(4-フェニル-1-ピペラジニル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]メチル、[2-(3-チエニル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]メチル、[2-(2-ピリジル)-6-(3-チエニル)- (3-,4-又は5-)ピリジル]プロピル、4-(3-アニリノ)-(2-,4-,5-又は6-)ピリジル)ブチル、5-[2-(4-モルホリノ)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]ペンチル、6-[2-(1-ピペリジニル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]ヘキシル、[2-(2-ピリジル)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]メチル、[2-(N-メチルアニリノ)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]メチル、2-[2-(N-エチルアニリノ)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]エチル、3-[2-(N-n-プロピルアニリノ)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]プロピル、4-[2-(N-n-ブチルアニリノ)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]エチル、5-[2-(N-n-ペンチルアニリノ)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]ペンチル、6-[2-(N-n-ヘキシルアニリノ)- (3-,4-,5-又は6-)ピリジル]ヘキシル基等のピリジン環上に置換基として前記例示のハロゲン原子；ピペリジニル基；モルホリノ基；前記例示のピペラジン環上に置換基としてフェニル基及び炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるピペラジニル基；チエニル基；フェニル基；ピリジル基及び前記例示のアミノ基上に炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を有することのあるアニリノ基なる群から選ばれた基を1~3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基を例示できる。

【0049】

シアノ低級アルキル基としては、例えば、シアノメチル、2-シアノエチル、1-シアノエチル、3-シアノプロピル、4-シアノブチル、1,1-ジメチル-2-シアノエチル、5-シアノペンチル、6-シアノヘキシル、1-シアノイソプロピル、2-メチル-3-シアノプロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるシアノアルキル基を例示できる。

【0050】

キノリル低級アルキル基としては、例えば、[(2-,3-,4-,5-,6-,7-

又は8-) キノリル] メチル、2-[(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) キノリル] エチル、1-[(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) キノリル] エチル、3-[(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) キノリル] プロピル、4-[(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) キノリル] プチル、1, 1-ジメチル-2-[(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) キノリル] エチル、5-[(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) キノリル] ペンチル、6-[(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) キノリル] ヘキシル、1-[(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) キノリル] イソプロピル、2-メチル-3-[(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) キノリル] プロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるキノリルアルキル基を例示できる。

【0051】

低級アルコキシ低級アルコキシ置換低級アルキル基としては、例えば、メトキシメトキシメチル、2-(メトキシメトキシ)エチル、1-(エトキシメトキシ)エチル、3-(2-n-ブトキシエトキシ)プロピル、4-(3-n-プロポキシプロポキシ)ブチル、1, 1-ジメチル-2-(4-n-ペンチルオキシブトキシ)エチル、5-(5-n-ヘキシルオキシペンチルオキシ)ペンチル、6-(6-メトキシヘキシルオキシ)ヘキシル、1-エトキシメトキシイソプロピル、2-メチル-3-(2-メトキシエトキシ)プロピル、3, 3-ジメチル-3-(メトキシメトキシ)プロピル基等の2つのアルコキシ部分が共に炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるアルコキシアルコキシ置換アルキル基を例示できる。

【0052】

水酸基置換低級アルキル基としては、例えば、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、2, 3-ジヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシブチル、3, 4-ジヒドロキシブチル、1, 1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル、5-ヒドロキシペンチル、6-ヒドロキシヘキシル、3, 3-ジメチル-3-ヒドロキシプロピル、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル、2, 3, 4-トリヒドロキシブチル基等の水酸基を1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

【0053】

カルボキシ低級アルコキシ基としては、例えば、カルボキシメトキシ、2-カルボキシエトキシ、1-カルボキシエトキシ、3-カルボキシプロポキシ、4-カルボキシブトキシ、5-カルボキシペンチルオキシ、6-カルボキシヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-カルボキシエトキシ、2-メチル-3-カルボキシプロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるカルボキシアルコキシ基を例示できる。

【0054】

低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基としては、例えば、メトキシカルボニルメトキシ、エトキシカルボニルメトキシ、2-メトキシカルボニルエトキシ、2-エトキシカルボニルエトキシ、1-エトキシカルボニルエトキシ、3-メトキシカルボニルプロポキシ、3-エトキシカルボニルプロポキシ、4-エトキシカルボニルブトキシ、5-イソプロポキシカルボニルベンチルオキシ、6-n-プロポキシカルボニルヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-n-ブトキシカルボニルエトキシ、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニルプロポキシ、2-n-ペンチルオキシカルボニルエトキシ、n-ヘキシルオキシカルボニルメトキシ基等の2つのアルコキシ部分が共に炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアルコキシカルボニルアルコキシ基を例示できる。

【0055】

ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基としては、前記低級アルキル基に加えて、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロメチル、プロモメチル、フルオロメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジプロモメチル、2-クロロエチル、2, 2,

2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、4, 4, 4-トリクロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、3-クロロ-2-メチルプロピル、5-ブロモヘキシル、5, 6-ジブロモヘキシル基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0056】

ハロゲン原子を有することのある低級アルキルチオ基としては、例えば、前記低級アルキルチオ基に加えて、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、クロロメチルチオ、ブロモメチルチオ、フルオロメチルチオ、ヨードメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、ジブロモメチルチオ、2-クロロエチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリクロロエチルチオ、3-クロロプロピルチオ、2, 3-ジクロロプロピルチオ、4, 4, 4-トリクロロブチルチオ、4-フルオロブチルチオ、5-クロロペンチルチオ、3-クロロ-2-メチルプロピルチオ、5-ブロモヘキシルチオ、5, 6-ジブロモヘキシルチオ基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基を例示できる。

【0057】

低級アルキルスルホニル基としては、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、t e r t -ブチルスルホニル、s e c -ブチルスルホニル、n-ペンチルスルホニル、イソペンチルスルホニル、ネオペンチルスルホニル、n-ヘキシルスルホニル、イソヘキシルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基を例示できる。

【0058】

フェニル低級アルケニル基としては、例えば、スチリル、3-フェニル-2-プロペニル基（慣用名：シンナミル基）、4-フェニル-2-ブテニル基、4-フェニル-3-ブテニル基、5-フェニル-4-ペンテニル基、5-フェニル-3-ペンテニル基、6-フェニル-5-ヘキセニル基、6-フェニル-4-ヘキセニル基、6-フェニル-3-ヘキセニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニル基、6-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニル基等のアルケニル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状のアルケニル基であり、二重結合を1～3個有するフェニルアルケニル基を例示できる。

【0059】

低級アルカノイルオキシ基としては、例えば、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、イソブチリルオキシ、ペンタノイルオキシ、t e r t -ブチルカルボニルオキシ、ヘキサノイルオキシ基等の炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基が挙げられる。

【0060】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子を有することのある低級アルキルチオ基、低級アルコキシ基、ニトロ基、低級アルキルスルホニル基、低級アルコキシカルボニル基、フェニル低級アルケニル基、低級アルカノイルオキシ基及び1, 2, 3-チオジアゾリル基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基としては、例えば、ベンジルオキシ、2-フェニルエトキシ、1-フェニルエトキシ、3-フェニルプロポキシ、4-フェニルブトキシ、5-フェニルペンチルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシ、2-メチル-3-フェニルプロポキシ、4-クロロベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-クロロベンジルオキシ、3-フルオロベンジルオキシ、4-フルオロベンジルオキシ、2, 4-ジブロモベンジルオキシ、2, 4, 6-トリフルオロベンジルオキシ、3-トリフルオロメチルベンジルオキシ、4-トリフルオロメチルベンジルオキシ、4-メチルベンジルオキシ、3-メチルベンジルオキシ、2, 4-ジメチルベンジルオキシ、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシ、4-メトキシカル

ボニルベンジルオキシ、3-メトキシベンジルオキシ、2-メトキシベンジルオキシ、3-メトキシカルボニルベンジルオキシ、2, 3-ジメトキシベンジルオキシ、2, 4, 5-トリメトキシベンジルオキシ、3-ニトロベンジルオキシ、2-(2, 3-ジニトロフェニル)エトキシ、3-(2, 4, 6-トリニトロフェニル)エトキシ、2-ニトロ-4-メチルベンジルオキシ、4-メチルスルホニルベンジルオキシ、4-(4-エチルスルホニルフェニル)ブトキシ、5-(4-プロピルスルホニルフェニル)ベンチルオキシ、4-アセチルオキシベンジルオキシ、6-(4-プロピオニルオキシフェニル)ヘキシルオキシ、4-スチリルベンジルオキシ、4-(1, 2, 3-チオジアゾール-4-イル)ベンジルオキシ、4-トリフルオロメチルチオベンジルオキシ、3-メチルチオベンジルオキシ、2, 4-ジメチルチオベンジルオキシ、2, 4, 6-トリメトルチオベンジルオキシ基等のフェニル環上に置換基として前記例示のハロゲン原子、前記例示のハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、前記例示のハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基、前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、ニトロ基、前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基、前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基、前記例示のアルケニル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状のアルケニル基であり、二重結合を1~3個有するフェニルアルケニル基、前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基及び1, 2, 3-チオジアゾリル基なる群から選ばれた基1~3個を有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基を例示できる。

【0061】

ペペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるペペリジニル低級アルコキシ基としては、例えば、[(1-、2-、3-又は4-)ペペリジニル]メトキシ、2-[(1-、2-、3-又は4-)ペペリジニル]エトキシ、1-[(1-、2-、3-又は4-)ペペリジニル]プロポキシ、4-[(1-、2-、3-又は4-)ペペリジニル]ブトキシ、5-[(1-、2-、3-又は4-)ペペリジニル]ベンチルオキシ、6-[(1-、2-、3-又は4-)ペペリジニル]ヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-[(1-、2-、3-又は4-)ペペリジニル]エトキシ、2-メチル-3-[(1-、2-、3-又は4-)ペペリジニル]プロポキシ、[1-メチル-(2-、3-又は4-)ペペリジニル]メトキシ、2-[1-エチル-(2-、3-又は4-)ペペリジニル]エトキシ、3-[1-n-プロピル-(2-、3-又は4-)ペペリジニル]プロポキシ、4-[1-n-ブチル-(2-、3-又は4-)ペペリジニル]ブトキシ、5-[1-n-ペンチル-(2-、3-又は4-)ペペリジニル]ベンチルオキシ、6-[1-n-ヘキシル-(2-、3-又は4-)ペペリジニル]ヘキシルオキシ、[1, 2-ジメチル-(3-、4-、5-又は6-)ペペリジニル]メトキシ、[1, 2, 3-トリメチル-(4-、5-又は6-)ペペリジニル]メトキシ、2-[2-n-プロピル-(3-、4-、5-又は6-)ペペリジニル]エトキシ、2-[3-エチル-(2-、4-、5-又は6-)ペペリジニル]エトキシ、[2-メチル-4-イソプロピル-(3-、5-又は6-)ペペリジニル]メトキシ、[1-メチル-(2-、3-又は4-)ペペリジニル]メトキシ基等のペペリジン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるペペリジニルアルコキシ基を例示できる。

【0062】

低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルコキシ基としては、例えば、アミノメトキシ、2-アミノメトキシ、1-アミノエトキシ、3-アミノプロポキシ、4-アミノブトキシ、5-アミノベンチルオキシ、6-アミノヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-アミノエトキシ、2-メチル-3-アミノプロポキシ、メチルアミノメトキシ、1-エチルアミノエトキシ、2-n-プロピルアミノエトキシ、3-イソプロピルアミノプロポキシ、4-n-ブチルアミノブトキシ、5-n-ペンチルアミノペンチルオキシ

、6-n-ヘキシルアミノヘキシルオキシ、ジメチルアミノメトキシ、3-ジメチルアミノプロポキシ、2-ジイソプロピルアミノエトキシ、(N-エチル-N-n-プロピルアミノ)メトキシ、2-(N-メチル-N-n-ヘキシルアミノ)エトキシ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0063】

低級アルケニルオキシ基としては、例えばビニルオキシ、1-プロペニルオキシ、1-メチル-1-プロペニルオキシ、2-メチル-1-プロペニルオキシ、2-プロペニルオキシ、2-ブテニルオキシ、1-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシ、2-ペンテニルオキシ、1-ペンテニルオキシ、3-ペンテニルオキシ、4-ペンテニルオキシ、1, 3-ブタジエニルオキシ、1, 3-ペンタジエニルオキシ、2-ペンテン-4-イニルオキシ、2-ヘキセニルオキシ、1-ヘキセニルオキシ、5-ヘキセニルオキシ、3-ヘキセニルオキシ、4-ヘキセニルオキシ、3, 3-ジメチル-1-プロペニルオキシ、2-エチル-1-プロペニルオキシ、1, 3, 5-ヘキサトリエニルオキシ、1, 3-ヘキサジエニルオキシ、1, 4-ヘキサジエニルオキシ基等の二重結合を1～3個有する炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニルオキシ基を例示できる。

【0064】

ピリジン環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換の低級アルキル基を有するとのあるピリジル低級アルコキシ基としては、例えば、[(2-、3-又は4-)ピリジル]メトキシ、2-[(2-、3-又は4-)ピリジル]エトキシ、1-[(2-、3-又は4-)ピリジル]エトキシ、3-[(2-、3-又は4-)ピリジル]プロポキシ、4-[(2-、3-又は4-)ピリジル]ブトキシ、5-[(2-、3-又は4-)ピリジル]ペンチルオキシ、6-[(2-、3-又は4-)ピリジル]ヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-[(2-、3-又は4-)ピリジル]エトキシ、2-メチル-3-[(2-、3-又は4-)ピリジル]プロポキシ、[2-トリフルオロメチル-(3-, 4-, 5-又は6-)ピリジル]メトキシ、[2-, 4-ジメチル-(3-, 5-又は6-)ピリジル]メトキシ、[2, 4, 6-トリメチル-(3-又は5-)ピリジル]メトキシ、[2-トリフルオロメチル-4-メチル-(3-, 5-又は6-)ピリジル]メトキシ、2-[3-エチル-(2-, 4-, 5-又は6-)ピリジル]エトキシ、3-[4-n-プロピル-(2-, 3-, 5-又は6-)ピリジル]プロポキシ、4-[3-n-ブチル-(2-, 4-, 5-又は6-)ピリジル]ブチル、5-[3-トリフルオロメチル-(2-, 4-, 5-又は6-)ピリジル]ペンチルオキシ、6-[2-n-ペンチル-(3-, 4-, 5-又は6-)ピリジル]ヘキシルオキシ、[2-n-ヘキシル-(3-, 4-, 5-又は6-)ピリジル]メトキシ基等のピリジン環上に置換基として前記例示のハロゲン原子1～3個を有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個することがあり、アルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるピリジルアルコキシ基を例示できる。

【0065】

低級アルキニルオキシ基としては、例えば、エチニルオキシ、2-プロピニルオキシ、2-ブチニルオキシ、3-ブチニルオキシ、1-メチル-2-プロピニルオキシ、2-ペンチニルオキシ、2-ヘキシニルオキシ基等の炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルキニルオキシ基を例示できる。

【0066】

フェニル低級アルキニルオキシ基としては、例えば、2-フェニルエチニルオキシ、3-フェニル-2-プロピニルオキシ、4-フェニル-2-ブチニルオキシ、4-フェニル-3-ブチニルオキシ、3-フェニル-1-メチル-2-プロピニルオキシ、5-フェニル-2-ペンチニルオキシ、6-フェニル-2-ヘキシニルオキシ基等のアルキニルオキシ部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルキニルオキシであるフェニルアルキニルオキシ基を例示できる。

【0067】

フェニル低級アルケニルオキシ基としては、例えば、スチリルオキシ、3-フェニル-1-プロペニルオキシ、3-フェニル-1-メチル-1-プロペニルオキシ、3-フェニル-2-メチル-1-プロペニルオキシ、3-フェニル-2-プロペニルオキシ、4-フェニル-2-ブテニルオキシ、4-フェニル-1-ブテニルオキシ、4-フェニル-3-ブテニルオキシ、4-フェニル-2-ペンテニルオキシ、5-フェニル-1-ペンテニルオキシ、5-フェニル-3-ペンテニルオキシ、5-フェニル-4-ペンテニルオキシ、4-フェニル-1, 3-ブタジエニルオキシ、5-フェニル-1, 3-ペンタジエニルオキシ、5-フェニル-2-ペンテン-4-イニルオキシ、6-フェニル-2-ヘキセニルオキシ、1-ヘキセニルオキシ、6-フェニル-5-ヘキセニルオキシ、6-フェニル-3-ヘキセニルオキシ、6-フェニル-4-ヘキセニルオキシ、3-フェニル-3, 3-ジメチル-1-プロペニルオキシ、3-フェニル-2-エチル-1-プロペニルオキシ、6-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニルオキシ、6-フェニル-1, 3-ヘキサジエニルオキシ、6-フェニル-1, 4-ヘキサジエニルオキシ基等のアルケニルオキシ部分が二重結合を1～3個有する炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニルオキシ基であるフェニルアルケニルオキシ基を例示できる。

【0068】

フラン環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基を有することのあるフリル低級アルコキシ基としては、例えば、[(2-又は3-)フリル]メトキシ、2-[(2-又は3-)フリル]エトキシ、1-[(2-又は3-)フリル]エトキシ、3-[(2-又は3-)フリル]プロポキシ、4-[(2-又は3-)フリル]ブトキシ、5-[(2-又は3-)フリル]ペンチルオキシ、6-[(2-又は3-)フリル]ヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-[(2-又は3-)フリル]エトキシ、2-メチル-3-[(2-又は3-)フリル]プロポキシ、[2-エトキシカルボニル-(3-, 4-又は5-)フリル]メトキシ、[2-メトキシカルボニル-(3-, 4-又は5-)フリル]メトキシ、[3-n-プロポキシカルボニル-(2-, 4-又は5-)フリル]メトキシ、[2-n-ブトキシカルボニル-(3-, 4-又は5-)フリル]メトキシ、[3-n-ペンチルオキシカルボニル-(2-, 4-又は5-)フリル]メトキシ、[2-n-ヘキシルオキシカルボニル-(3-, 4-又は5-)フリル]メトキシ、[2, 3-ジエトキシカルボニル-(4-又は5-)フリル]メトキシ、(2, 3, 4-トリメトキシカルボニル-5-フリル)メトキシ、2-[3-n-プロポキシカルボニル-(2-, 4-又は5-)フリル]エトキシ、3-[2-n-ブトキシカルボニル-(3-, 4-又は5-)フリル]プロポキシ、4-[3-n-ペンチルオキシカルボニル-(2-, 4-又は5-)フリル]ブトキシ、5-[2-n-ヘキシルオキシカルボニル-(3-, 4-又は5-)フリル]ペンチルオキシ、6-[2-n-ヘキシルオキシカルボニル-(3-, 4-又は5-)フリル]ヘキシルオキシ基等のフラン環上に置換基として前記例示のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシであるアルコキシカルボニル基を1～3個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシであるフリルアルコキシ基を例示できる。

【0069】

テトラゾール環上に置換基としてフェニル低級アルキル基、フェニル基及びシクロアルキル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるテトラゾリル低級アルコキシ基としては、例えば、[(1-又は5-)テトラゾリル]メトキシ、2-[(1-又は5-)テトラゾリル]エトキシ、1-[(1-又は5-)テトラゾリル]エトキシ、3-[(1-又は5-)テトラゾリル]プロポキシ、4-[(1-又は5-)テトラゾリル]ブトキシ、5-[(1-又は5-)テトラゾリル]ペンチルオキシ、6-[(1-又は5-)テトラゾリル]ヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-[(1-又は5-)テトラゾリル]エトキシ、2-メチル-3-[(1-又は5-)テトラゾリル]プロポキシ、(1-ペンジル-5-テトラゾリル)メトキシ、(1-フェニル-5-テトラゾリル)メトキシ、(1-シクロヘキシルメチル-5-テトラゾリル)メトキシ、[5-(2-フェニ

ルエチル) - 1-テトラゾリル] メトキシ、 [1- (1-フェニルエチル) - 1-テトラゾリル] メトキシ、 [1- (3-フェニルプロピル) - 1-テトラゾリル] メトキシ、 [5- (4-フェニルブチル) - 1-テトラゾリル] メトキシ、 [1- (5-フェニルペンチル) - 1-テトラゾリル] メトキシ、 [1- (6-フェニルヘキシル) - 1-テトラゾリル] メトキシ、 [5- (2-シクロヘキシルエチル) - 1-テトラゾリル] メトキシ、 [1- (1-シクロプロピルエチル) - 5-テトラゾリル] メトキシ、 [1- (3-シクロブチルプロピル) - 5-テトラゾリル] メトキシ、 [5- (4-シクロペンチルブチル) - 1-テトラゾリル] メトキシ、 [1- (5-シクロヘプチルペンチル) - 5-テトラゾリル] メトキシ、 [1- (6-シクロオクチルヘキシル) - 5-テトラゾリル] メトキシ、 2- (1-フェニル-5-テトラゾリル) エトキシ、 3- (1-シクロヘキシルメチル-5-テトラゾリル) プロポキシ、 4- [5- (2-フェニルエチル) - 1-テトラゾリル] ブトキシ、 5- (1-ベンジル-5-テトラゾリル) ペンチルオキシ、 6- (1-フェニル-5-テトラゾリル) ヘキシルオキシ、 1- (1-シクロヘキシルメチル-5-テトラゾリル) エトキシ等のテトラゾール環上に置換基として、前記例示のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基、フェニル基及び前記例示のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である炭素数3～8のシクロアルキルアルキル基なる群から選ばれた基を1個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシであるテトラゾリルアルコキシ基を例示できる。

【0070】

フェニル基(フェニル環上に低級アルキル基が置換していてもよい)としては、例えば、フェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-エチルフェニル、4-エチルフェニル、4-イソプロピルフェニル、3-n-ブチルフェニル、4-n-ペンチルフェニル、4-n-ヘキシルフェニル、3, 4-ジメチルフェニル、3, 4-ジエチルフェニル、2, 4-ジメチルフェニル、2, 5-ジメチルフェニル、2, 6-ジメチルフェニル、3, 4, 5-トリメチルフェニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0071】

1, 2, 4-オキサジアゾール環上にフェニル基(フェニル環上に低級アルキル基が置換していてもよい)を有することのある1, 2, 4-オキサジアゾリル低級アルコキシ基としては、例えば、 [(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル] メトキシ、 2- [(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル] エトキシ、 1- [(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル] エトキシ、 3- [(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル] プロポキシ、 4- [(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル] ブトキシ、 5- [(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル] ペンチルオキシ、 6- [(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル] ヘキシルオキシ、 1, 1-ジメチル-2- [(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル] エトキシ、 2-メチル-3- [(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル] プロポキシ、 [3- (4-tert-ブチルフェニル) - 5-1, 2, 4-オキサジアゾリル] メトキシ、 [3- (3-メチルフェニル) - 5-1, 2, 4-オキサジアゾリル] メトキシ、 [5- (2-エチルフェニル) - 3-1, 2, 4-オキサジアゾリル] メトキシ、 [3- (4-n-プロピルフェニル) - 5-1, 2, 4-オキサジアゾリル] メトキシ、 [5- (3-n-ペンチルフェニル) - 3-1, 2, 4-オキサジアゾリル] メトキシ、 [3- (2-n-ヘキシルフェニル) - 5-1, 2, 4-オキサジアゾリル] メトキシ、 [3- (2, 4-ジメチルフェニル) - 5-1, 2, 4-オキサジアゾリル] メトキシ、 [3- (2, 3, 5-トリメチルフェニル) - 5-1, 2, 4-オキサジアゾリル] メトキシ、 2- [3- (4-tert-ブチルフェニル) - 5-1, 2, 4-オキサジアゾリル] エトキシ、 1- [3- (3-メチルフェニル) - 5-1, 2, 4-オキサジアゾリル] エトキシ、 3- [5- (2-エチルフェニル) - 3-1, 2, 4-オキサジアゾリル] プロポキシ、 4- [3- (4-n-

—プロピルフェニル) —5—1, 2, 4—オキサジアゾリル] プトキシ、5—[5—(3—n—ペンチルフェニル) —3—1, 2, 4—オキサジアゾリル] ペンチルオキシ、6—[3—(2—n—ヘキシルフェニル) —5—1, 2, 4—オキサジアゾリル] ヘキシルオキシ、2—[3—(2, 4—ジメチルフェニル) —5—1, 2, 4—オキサジアゾリル] エトキシ、1—[3—(2, 3, 5—トリメチルフェニル) —5—1, 2, 4—オキサジアゾリル] エトキシ基等の1, 2, 4—オキサジアゾール環上に置換基として前記例示のフェニル基(フェニル環上に炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基が1~3個置換していてもよい)を1個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシである1, 2, 4—オキサジアゾリルアルコキシ基を例示できる。

【0072】

イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリル低級アルコキシ基としては、例えば、[(3—、4—又は5—)イソオキサゾリル] メトキシ、2—[(3—、4—又は5—)イソオキサゾリル] エトキシ、1—[(3—、4—又は5—)イソオキサゾリル] エトキシ、3—[(3—、4—又は5—)イソオキサゾリル] プロポキシ、4—[(3—、4—又は5—)イソオキサゾリル] プトキシ、5—[(3—、4—又は5—)イソオキサゾリル] ペンチルオキシ、6—[(3—、4—又は5—)イソオキサゾリル] ヘキシルオキシ、1, 1—ジメチル—2—[(3—、4—又は5—)イソオキサゾリル] エトキシ、2—メチル—3—[(3—、4—又は5—)イソオキサゾリル] プロポキシ、(3, 5—ジメチル—4—イソオキサゾリル) メトキシ、[3—メチル—(4—又は5—)イソオキサゾリル] メトキシ、[3—エチル—(4—又は5—)イソオキサゾリル] メトキシ、[4—n—プロピル—(3—又は5—)イソオキサゾリル] メトキシ、[5—n—ブチル—(3—又は4—)イソオキサゾリル] メトキシ、[3—n—ペンチル—(4—又は5—)イソオキサゾリル] メトキシ、[4—n—ヘキシル—(3—又は5—)イソオキサゾリル] メトキシ、
2—[3—メチル—(4—又は5—)イソオキサゾリル] エトキシ、1—[3—エチル—(4—又は5—)イソオキサゾリル] エトキシ、3—[4—n—プロピル—(3—又は5—)イソオキサゾリル] プロポキシ、4—[5—n—ブチル—(3—又は4—)イソオキサゾリル] ブトキシ、5—[3—n—ペンチル—(4—又は5—)イソオキサゾリル] ペンチルオキシ、6—[4—n—ヘキシル—(3—又は5—)イソオキサゾリル] ヘキシルオキシ基等のイソオキサゾール環上に置換基として前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシであるイソオキサゾリルアルコキシ基を例示できる。

【0073】

1, 3, 4—オキサジアゾール環上にフェニル基(フェニル環上に低級アルキル基が置換していてもよい)を有することのある1, 3, 4—オキサジアゾリル低級アルコキシ基としては、例えば、[(2—又は5—)1, 3, 4—オキサジアゾリル] メトキシ、2—[(2—又は5—)1, 3, 4—オキサジアゾリル] エトキシ、1—[(2—又は5—)1, 3, 4—オキサジアゾリル] エトキシ、3—[(2—又は5—)1, 3, 4—オキサジアゾリル] ブロポキシ、4—[(2—又は5—)1, 3, 4—オキサジアゾリル] ブトキシ、5—[(2—又は5—)1, 3, 4—オキサジアゾリル] ペンチルオキシ、6—[(2—又は5—)1, 3, 4—オキサジアゾリル] ヘキシルオキシ、1, 1—ジメチル—2—[(2—又は5—)1, 3, 4—オキサジアゾリル] エトキシ、2—メチル—3—[(2—又は5—)1, 3, 4—オキサジアゾリル] ブロポキシ、[2—(4—tert—ブチルフェニル) —5—1, 3, 4—オキサジアゾリル] メトキシ、[2—(4—メチルフェニル) —5—1, 3, 4—オキサジアゾリル] メトキシ、[5—(2—エチルフェニル) —2—1, 3, 4—オキサジアゾリル] メトキシ、[2—(4—n—プロピルフェニル) —5—1, 3, 4—オキサジアゾリル] メトキシ、[5—(3—n—ペンチルフェニル) —2—1, 3, 4—オキサジアゾリル] メトキシ、[2—(2—n—ヘキシルフェニル) —5—1, 3, 4—オキサジアゾリル] メトキシ、[2—(2, 4—ジメチルフェニル) —5—1, 3, 4—オキサジアゾリル] メトキシ、[2—(2, 3, 5—トリメチルフェニル) —5—1, 3, 4—オキサジアゾリル] メトキシ、

フェニル) -5-1, 3, 4-オキサジアゾリル] メトキシ、2-[2-(4-tert-ブチルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリル] エトキシ、1-[2-(3-メチルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリル] エトキシ、3-[5-(2-エチルフェニル)-2-1, 3, 4-オキサジアゾリル] プロポキシ、4-[2-(4-n-プロピルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリル] ブトキシ、5-[5-(3-n-ペンチルフェニル)-2-1, 3, 4-オキサジアゾリル] ペンチルオキシ、6-[2-(2-n-ヘキシルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリル] ヘキシルオキシ、2-[2-(2, 4-ジメチルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリル] エトキシ、1-[2-(2, 3, 5-トリメチルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリル] エトキシ基等の1, 3, 4-オキサジアゾール環上に置換基として前記例示のフェニル基(フェニル環上に炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基が1~3個置換していてもよい)を1個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシである1, 3, 4-オキサジアゾリルアルコキシ基を例示できる。

[0074]

低級アルカノイル低級アルコキシ基としては、例えば、アセチルメトキシ、プロピオニルメトキシ、2-アセチルエトキシ、2-プロピオニルエトキシ、1-アセチルエトキシ、3-アセチルプロポキシ、3-プロピオニルプロポキシ、4-アセチルブトキシ、5-ブチリルペンチルオキシ、6-ペンタノイルヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-ヘキサノイルエトキシ、2-メチル-3-アセチルプロポキシ、2-ペンタノイルエトキシ、ヘキサノイルメトキシ基等のアルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であり、アルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアルカノイルアルコキシ基を例示できる。

[0075]

フェニル基（フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい）としては、例えば、フェニル、4-フルオロフェニル、2, 5-ジフルオロフェニル、2, 4-ジフルオロフェニル、3, 4-ジフルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 3-ジクロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、3-フルオロフェニル、2-フルオロフェニル、3-ブロモフェニル、4-ヨードフェニル、2-ブロモフェニル、4-ブロモフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、2, 4, 6-トリフルオロフェニル、3, 4-ジフルオロフェニル、2-ヨードフェニル、3-ヨードフェニル、4-ヨードフェニル、2, 3-ジブロモフェニル、2, 4-ジヨードフェニル、2, 4, 6-トリクロロフェニル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子1～3個を有することのあるフェニル基を例示できる。

[0076]

チアゾール環上に置換基としてフェニル基（フェニル環上にハロゲン原子が置換してもよい）及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるチアゾリル低級アルコキシ基としては、例えば、[（2-、4-又は5-）チアゾリル]メトキシ、2-[（2-、4-又は5-）チアゾリル]エトキシ、1-[（2-、4-又は5-）チアゾリル]エトキシ、3-[（2-、4-又は5-）チアゾリル]プロポキシ、4-[（2-、4-又は5-）チアゾリル]ブトキシ、5-[（2-、4-又は5-）チアゾリル]ベンチルオキシ、6-[（2-、4-又は5-）チアゾリル]ヘキシリルオキシ、1,1-ジメチル-2-[（2-、4-又は5-）チアゾリル]エトキシ、2-メチル-3-[（2-、4-又は5-）チアゾリル]プロポキシ、[2-フェニル-（4-又は5-）チアゾリル]メトキシ、[2-（4-クロロフェニル）-4-メチル-5-チアゾリル]メトキシ、[2-（3-プロモフェニル）-（4-又は5-）チアゾリル]メトキシ、[2-（3,4-ジクロロフェニル）-（4-又は5-）チアゾリル]メトキシ、[2-（2,4,6-トリフルオロフェニル）-（4-又は5-）チアゾリル]メトキシ、[2-メチル-（4-又は5-）チアゾリル]メトキシ、[2-メチル-（4-又は5-）チアゾリル]メトキシ、

5-) チアゾリル] メトキシ、2-[2-エチル-(4-又は5-)チアゾリル] メトキシ、2-[4-フェニル-(2-又は5-)チアゾリル] エトキシ、3-[5-n-プロピル-(2-又は4-)チアゾリル] プロポキシ、4-[4-n-ブチル-(2-又は5-)チアゾリル] ブトキシ、5-[2-n-ペンチル-(4-又は5-)チアゾリル] ペンチルオキシ、6-[5-n-ヘキシル-(2-又は4-)チアゾリル] ヘキシルオキシ、[2, 4-ジメチル-5-チアゾリル] メトキシ、[2, 4-ジフェニル-5-チアゾリル] メトキシ基等のチアゾール環上に置換基として前記例示のフェニル基(フェニル環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよい)及び炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群から選ばれた基を1~2個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるチアゾリルアルコキシ基を例示できる。

【0077】

ベンゾイル基(フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾイル、4-フルオロベンゾイル、2, 5-ジフルオロベンゾイル、2, 4-ジフルオロベンゾイル、3, 4-ジフルオロベンゾイル、3, 5-ジフルオロベンゾイル、2, 6-ジフルオロベンゾイル、2-クロロベンゾイル、3-クロロベンゾイル、4-クロロベンゾイル、2, 3-ジクロロベンゾイル、2, 4-ジクロロベンゾイル、2, 5-ジクロロベンゾイル、3, 4-ジクロロベンゾイル、2, 6-ジクロロベンゾイル、3-フルオロベンゾイル、2-フルオロベンゾイル、3-ブロモベンゾイル、4-ヨードルベンゾイル、2-ブロモベンゾイル、4-ブロモルベンゾイル、3, 5-ジクロロベンゾイル、2, 4, 6-トリフルオロベンゾイル、2-ヨードベンゾイル、3-ヨードベンゾイル、4-ヨードベシゾイル、2, 3-ジブロモベンゾイル、2, 4-ジヨードベンゾイル、2, 4, 6-トリクロロベンゾイル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子1~3個を有することのあるベンゾイル基を例示できる。

【0078】

ピペリジン環上に置換基としてベンゾイル基(フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい)を有することのあるピペリジニルオキシ基としては、例えば、(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニルオキシ、1-(4-クロロベンゾイル)-(2-、3-又は4-)ピペリジニルオキシ、1-(3-ブロモベンゾイル)-(2-、3-又は4-)ピペリジニルオキシ、1-ベンゾイル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルオキシ、1-(2-フルオロベンゾイル)-(2-、3-又は4-)ピペリジニルオキシ、1-(2, 4-ジクロロベンゾイル)-(2-、3-又は4-)ピペリジニルオキシ、1-(2, 4, 6-トリフルオロベンゾイル)-(2-、3-又は4-)ピペリジニルオキシ、2-(3-クロロベンゾイル)-(1-、3-又は4-)ピペリジニルオキシ、3-(2-クロロベンゾイル)-(1-、2-又は4-)ピペリジニルオキシ、4-(2, 3-ジブロモベンゾイル)-(1-、2-又は3-)ピペリジニルオキシ、1, 2-ジベンゾイル-(3-又は4-)ピペリジニルオキシ、1, 2, 4-トリベンゾイル-3-ピペリジニルオキシ基等のピペリジン環上に置換基として前記例示のベンゾイル基(フェニル環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよい)を1~3個有することのあるピペリジニルオキシ基を例示できる。

【0079】

チエニル低級アルコキシ基としては、例えば、[(2-又は3-)チエニル] メトキシ、2-[(2-又は3-)チエニル] エトキシ、1-[(2-又は3-)チエニル] エトキシ、3-[(2-又は3-)チエニル] プロポキシ、4-[(2-又は3-)チエニル] ブトキシ、5-[(2-又は3-)チエニル] ペンチルオキシ、6-[(2-又は3-)チエニル] ヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-[(2-又は3-)チエニル] エトキシ、2-メチル-3-[(2-又は3-)チエニル] プロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるチエニルアルコキシ基を例示できる。

【0080】

フェニルチオ低級アルコキシ基としては、例えば、フェニルチオメトキシ、2-フェニ

ルチオエトキシ、1-フェニルチオエトキシ、3-フェニルチオプロポキシ、4-フェニルチオブトキシ、5-フェニルチオペンチルオキシ、6-フェニルチオヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-フェニルチオエトキシ、2-メチル-3-フェニルチオプロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルチオアルコキシ基を挙げることができる。

【0081】

低級アルキル基を有することのあるカルバモイル置換低級アルコキシ基としては、例えば、カルバモイルメトキシ、2-カルバモイルエトキシ、1-カルバモイルエトキシ、3-カルバモイルプロポキシ、4-カルバモイルブトキシ、5-カルバモイルペンチルオキシ、6-カルバモイルヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-カルバモイルエトキシ、2-メチル-3-カルバモイルプロポキシ、メチルカルバモイルメトキシ、1-エチルカルバモイルエトキシ、2-n-プロピルカルバモイルエトキシ、3-イソプロピルカルバモイルプロポキシ、4-n-ブチルカルバモイルブトキシ、5-n-ペンチルカルバモイルペンチルオキシ、6-n-ヘキシルカルバモイルヘキシルオキシ、ジメチルカルバモイルメトキシ、3-ジメチルカルバモイルプロポキシ、2-ジイソプロピルカルバモイルエトキシ、(N-エチル-N-n-プロピルカルバモイル)メトキシ、2-(N-メチル-N-n-ヘキシルカルバモイル)エトキシ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるカルバモイル基が置換した炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0082】

ベンゾイル低級アルコキシ基としては、例えば、ベンゾイルメトキシ、2-ベンゾイルエトキシ、1-ベンゾイルエトキシ、3-ベンゾイルプロポキシ、4-ベンゾイルブトキシ、5-ベンゾイルペンチルオキシ、6-ベンゾイルヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-ベンゾイルエトキシ、2-メチル-3-ベンゾイルプロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるベンゾイルアルコキシ基を挙げることができる。

【0083】

ピリジルカルボニル低級アルコキシ基としては、例えば、[(2-、3-又は4-)ピリジルカルボニル]メトキシ、2-[(2-、3-又は4-)ピリジルカルボニル]エトキシ、3-[(2-、3-又は4-)ピリジルカルボニル]エトキシ、1-[(2-、3-又は4-)ピリジルカルボニル]プロポキシ、4-[(2-、3-又は4-)ピリジルカルボニル]ブトキシ、5-[(2-、3-又は4-)ピリジルカルボニル]ペンチルオキシ、6-[(2-、3-又は4-)ピリジルカルボニル]ヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-[(2-、3-又は4-)ピリジルカルボニル]エトキシ、2-メチル-3-[(2-、3-又は4-)ピリジルカルボニル]プロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるピリジルカルボニルアルコキシ基を挙げることができる。

【0084】

イミダゾール環上に置換基としてフェニル低級アルキル基を有することのあるイミダゾリル低級アルコキシ基としては、例えば、[(1-、2-、4-又は5-)イミダゾリル]メトキシ、2-[(1-、2-、4-又は5-)イミダゾリル]エトキシ、1-[(1-、2-、4-又は5-)イミダゾリル]プロポキシ、4-[(1-、2-、4-又は5-)イミダゾリル]ブトキシ、5-[(1-、2-、4-又は5-)イミダゾリル]ペンチルオキシ、6-[(1-、2-、4-又は5-)イミダゾリル]ヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-[(1-、2-、4-又は5-)イミダゾリル]エトキシ、2-メチル-3-[(1-、2-、4-又は5-)イミダゾリル]プロポキシ、[1-ベンジル-(2-、4-又は5-)イミダゾリル]メトキシ、[1-(2-フェニルエチル)-(2-、4-又は5-)イミダゾリル]メトキシ、2-[2-(3-フェニルプロピル)-(1-、4-又は5-)イミダゾリル]エトキシ、3-[4-(4-フェニルブチル)-(1-、2-又は5-)イ

ミダゾリル) プロポキシ、5-[4-(5-フェニルペンチル)-1-, 2-又は4-)イミダゾリル] ペンチルオキシ、6-[1-(6-フェニルヘキシルオキシ)-2-, 4-又は5-)イミダゾリル] ヘキシルオキシ、[1, 2-ジベンジル-4-又は5-)イミダゾリル] メトキシ、[1, 2, 4-トリベンジル-5-イミダゾリル] メトキシ基等のイミダゾール環上に置換基として、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基であるフェニルアルキル基を1~3個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるイミダゾリルアルコキシ基を挙げができる。

【0085】

フェノキシ低級アルコキシ基としては、例えば、フェノキシメトキシ、2-フェノキシエトキシ、3-フェノキシプロポキシ、4-フェノキシブトキシ、5-フェノキシベンチルオキシ、6-フェノキシヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-フェノキシエトキシ、2-メチル-3-フェノキシプロポポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェノキシアルコキシ基を挙げができる。

【0086】

フェニル低級アルコキシ置換低級アルコキシ基としては、例えば、フェニルメトキシメトキシ、2-(フェニルメトキシ)エトキシ、1-(フェニルメトキシ)エトキシ、3-(フェニルメトキシ)プロポキシ、4-(フェニルメトキシ)ブトキシ、5-(フェニルメトキシ)ベンチルオキシ、6-(フェニルメトキシ)ヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-(フェニルメトキシ)エトキシ、2-メチル-3-(フェニルメトキシ)プロポキシ、1-(2-フェニルエトキシ)エトキシ、2-(1-フェニルエトキシ)エトキシ、3-(3-フェニルプロポキシ)プロポキシ、4-(4-フェニルブトキシ)ブトキシ、5-(5-フェニルベンチルオキシ)ベンチルオキシ、6-(6-フェニルヘキシルオキシ)ヘキシルオキシ、(1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシ)メトキシ、3-(2-メチル-3-フェニルプロポキシ)プロポキシ基等の2つのアルコキシ部分が共に炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ置換アルコキシ基を例示できる。

【0087】

イソインドリン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるイソインドリニル低級アルコキシ基としては、例えば、[(1-, 2-, 4-又は5-)イソインドリニル]メトキシ、2-[(1-, 2-, 4-又は5-)イソインドリニル]エトキシ、1-[(1-, 2-, 4-又は5-)イソインドリニル]エトキシ、3-[(1-, 2-, 4-又は5-)イソインドリニル]プロポキシ、4-[(1-, 2-, 4-又は5-)イソインドリニル]ブトキシ、5-[(1-, 2-, 4-又は5-)イソインドリニル]ベンチルオキシ、6-[(1-, 2-, 4-又は5-)イソインドリニル]ヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-[(1-, 2-, 4-又は5-)イソインドリニル]エトキシ、2-メチル-3-[(1-, 2-, 4-又は5-)イソインドリニル]プロポキシ、3-[1, 3-ジオキソ-(2-, 4-又は5-)イソインドリニル]プロポキシ、
[1-オキソ-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-)イソインドリニル]メトキシ、2-[1, 3-ジオキソ-(1-, 4-又は5-)イソインドリニル]エトキシ、4-[1-オキソ-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-)イソインドリニル]ブトキシ、5-[1, 3-ジオキソ-(1-, 4-又は5-)イソインドリニル]ベンチルオキシ、6-[1-オキソ-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-)イソインドリニル]ヘキシルオキシ基等のイソインドリン環上に置換基としてオキソ基を1~2個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるイソインドリニルアルコキシ基を例示できる。

【0088】

ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基としては、前記低級アルコキシ基に加えて、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、クロロメトキシ、プロモメトキシ

、フルオロメトキシ、ヨードメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジプロモメトキシ、2-クロロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、3-クロロプロポキシ、2, 3-ジクロロプロポキシ、4, 4, 4-トリクロロブロキシ、4-フルオロブロキシ、5-クロロベンチルオキシ、3-クロロ-2-メチルプロポキシ、5-ブロモヘキシルオキシ、5, 6-ジブロモヘキシルオキシ基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0089】

低級アルカノイル基としては、例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、tert-ブチルカルボニル、ヘキサノイル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基が挙げられる。

【0090】

低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、tert-ブチルカルボニルシアミノ、ヘキサノイルアミノ、N,N-ジアセチルアミノ、N-アセチル-N-ブロピオニルアミノ基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を1～2個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0091】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル基、低級アルコキシカルボニル基、フェノキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルホニル基、フェニル低級アルコキシ基及び低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、例えば、ベンジル、1-フェネチル、2-フェネチル、3-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルベンチル、4-フェニルベンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、1, 1-ジフェニルメチル、2, 2-ジフェニルエチル、3, 3-ジフェニルプロピル、1, 2-ジフェニルエチル、4-クロロベンジル、2-クロロベンジル、3-クロロベンジル、3-フルオロベンジル、4-フルオロベンジル、2, 3-ジクロロベンジル、2, 4, 6-トリフルオロベンジル、3-トリフルオロメチルベンジル、4-トリフルオロメチルベンジル、2-メチルベンジル、3-メチルベンジル、4-メチルベンジル、4-tert-ブチルベンジル、2, 4-ジメチルベンジル、2, 4, 6-トリメチルベンジル、2-フェニルベンジル、4-フェニルベンジル、2, 4-ジフェニルベンジル、2-トリフルオロメトキシベンジル、3-トリフルオロメトキシベンジル、4-トリフルオロメトキシベンジル、2-メトキシベンジル、3-メトキシベンジル、4-メトキシベンジル、3, 4-ジメトキシベンジル、3, 4, 5-トリメトキシベンジル、4-メトキシカルボニルベンジル、3-エトキシカルボニルベンジル、2-n-ブロポキシカルボニルベンジル、2, 4-ジメトキシカルボニルベンジル、2, 4, 6-トリメトキシカルボニルベンジル、4-tert-ブトキシカルボニルベンジル、3-フェノキシベンジル、2-フェノキシベンジル、4-フェノキシベンジル、3, 4-ジフェノキシベンジル、3, 4, 5-トリフェノキシベンジル、4-メチルチオベンジル、3-メチルチオベンジル、2-メチルチオベンジル、2, 4-ジメチルチオベンジル、2, 4, 6-トリメチルチオベンジル、4-メチルスルホニルベンジル、3-メチルスルホニルベンジル、2-メチルスルホニルベンジル、3, 4-ジメチルスルホニルベンジル、3, 4, 5-メトリチルスルホニルベンジル、4-ベンジルオキシベンジル、3-ベンジルオキシベンジル、2-ベンジルオキシベンジル、2, 4-ジベンジルオキシベンジル、2, 4, 6-トリベンジルオキシベンジル、4-メトキシ-3-クロロベンジル、4-(N-アセチルアミノ)ベンジル、3-アミノベンジル、2-アミノベンジル、4-アミノベンジル、2, 3-ジアミノベンジル、3, 4, 5-トリアミノベンジル、4-メチル-3-フルオロベンジル基等のフェニル環上に置換基として前記例示のハロゲン原子、前記例示

のハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、前記例示のハロゲン原子1～3個を有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、フェニル基、前記例示のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアルコキシカルボニル基、フェノキシ基、前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基、前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基、前記例示のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基及び前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基1～2個を有することのあるアミノなる群から選ばれた基を1～3個有することのあるフェニル基を1～2個有し、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

【0092】

ナフチル低級アルキル基としては、例えば、[(1-又は2-)ナフチル]メチル、1-[(1-又は2-)ナフチル]エチル、2-[(1-又は2-)ナフチル]エチル、3-[(1-又は2-)ナフチル]プロピル、2-[(1-又は2-)ナフチル]プロピル、4-[(1-又は2-)ナフチル]ブチル、5-[(1-又は2-)ナフチル]ペンチル、4-[(1-又は2-)ナフチル]ペンチル、6-[(1-又は2-)ナフチル]ヘキシル、2-メチル-3-[(1-又は2-)ナフチル]プロピル、1,1-ジメチル-2-[(1-又は2-)ナフチル]エチル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるナフチルアルキル基を例示できる。

【0093】

フラン環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基を有することのあるフリル低級アルキル基としては、例えば、[(2-又は3-)フリル]メチル、2-[(2-又は3-)フリル]エチル、1-[(2-又は3-)フリル]エチル、3-[(2-又は3-)フリル]プロピル、4-[(2-又は3-)フリル]ブチル、5-[(2-又は3-)フリル]ペンチル、6-[(2-又は3-)フリル]ヘキシル、1,1-ジメチル-2-[(2-又は3-)フリル]エチル、2-メチル-3-[(2-又は3-)フリル]プロピル、[5-エトキシカルボニル-(2-、3-又は4-)フリル]メチル、[5-メトキシカルボニル-(2-、3-又は4-)フリル]メチル、[2-n-プロポキシカルボニル-(3-、4-又は5-)フリル]メチル、[3-t-e-r-t-ブトキシカルボニル-(2-、4-又は5-)フリル]メチル、[4-n-ペンチルオキシカルボニル-(2-、3-又は5-)フリル]メチル、[2-n-ヘキシルオキシカルボニル-(3-、4-又は5-)フリル]メチル、[2,5-ジエトキシカルボニル-(3-又は4-)フリル]メチル、[2,4,5-トリエトキシカルボニル-3-フリル]メチル等のフラン環上に置換基としてアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアルコキシカルボニル基を1～3個を有することがあり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフリルアルキル基を例示できる。

【0094】

フェニル環上に置換基として低級アルキル基（低級アルキル基上にハロゲン原子が置換していてもよい）を有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-エチルフェニル、4-エチルフェニル、4-イソプロピルフェニル、3-n-ブチルフェニル、4-n-ペンチルフェニル、4-n-ヘキシルフェニル、3,4-ジメチルフェニル、3,4-ジエチルフェニル、2,4-ジメチルフェニル、2,5-ジメチルフェニル、2,6-ジメチルフェニル、3,4,5-トリメチルフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、3,5-ジトリフルオロメチルフェニル、2,4,6-トリ(トリフルオロメチル)フェニル、2-メチル-4-トリフルオロメチルフェニル基等のフェニル環上に置換基として前記例示のハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個置換していてもよいフェニル基を例示できる。

【0095】

チアゾール環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキル基（低級アルキル基上にハロゲン原子が置換していてもよい）を有することのあるフェニル基なる群から選ばれた基を有することのあるチアゾリル低級アルキル基としては、例えば、[(2-、4-又は5-) チアゾリル] メチル、2- [[(2-、4-又は5-) チアゾリル] エチル、1- [(2-、4-又は5-) チアゾリル] エチル、3- [(2-、4-又は5-) チアゾリル] プロピル、4- [(2-、4-又は5-) チアゾリル] ブチル、5- [(2-、4-又は5-) チアゾリル] ペンチル、6- [(2-、4-又は5-) チアゾリル] ヘキシル、1, 1-ジメチル-2- [(2-、4-又は5-) チアゾリル] エチル、[2-メチル-(4-又は5-) チアゾリル] メチル、[2- (4-トリフルオロメチルフェニル) - [(2-、4-又は5-) チアゾリル] メチル、2- [4-エチル-(2-又は5-) チアゾリル] エチル、1- [5- (3-メチルフェニル) - (2-又は4-) チアゾリル] エチル、3- [5-イソプロピル-(2-又は4-) チアゾリル] プロピル、4- [2- (2, 4-ジメチルフェニル) - (4-又は5-) チアゾリル] ブチル、5- [2-n-ブチル-(4-又は5-) チアゾリル] ペンチル、6- [4- (2, 4, 6-トリメチルフェニル) - (2-、4-又は5-) チアゾリル] ヘキシル、(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) メチル、[2- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 4-フェニル-5-チアゾリル] メチル、(2-ジメチル-4-フェニル-5-チアゾリル) メチル基等のチアゾール環上に置換基として前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び前記例示のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子1～3個を有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個置換してもよいフェニル基なる群から選ばれた基を1～2個有することがあり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるチアゾリルアルキル基を例示できる。

【0096】

テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル低級アルキル基としては、[(1又は5-) テトラゾリル] メチル、2- [(1又は5-) テトラゾリル] エチル、1- [(1又は5-) テトラゾリル] エチル、3- [(1又は5-) テトラゾリル] プロピル、4- [(1又は5-) テトラゾリル] ブチル、5- [(1又は5-) テトラゾリル] ペンチル、6- [(1又は5-) テトラゾリル] ブチル、5- (1-メチル-5-テトラゾリル) ペンチル、6- (1-メチル-5-テトラゾリル) ヘキシル、(5-メチル-1-テトラゾリル) メチル、2- (5-エチル-1-テトラゾリル) ヘキシル、1, 1-ジメチル-2- [(1又は5-) テトラゾリル] エチル、2-メチル-3- [(1又は5-) テトラゾリル] プロピル、(1-メチル-5-テトラゾリル) メチル、(1-エチル-5-テトラゾリル) メチル、2- (1-n-ブロピル-5-テトラゾリル) エチル、1- (1-n-ブチル-5-テトラゾリル) エチル、3- (1-n-ペンチル-5-テトラゾリル) プロピル、4- (1-n-ヘキシル-4-テトラゾリル) ブチル、3- (5-イソプロピル-1-テトラゾリル) プロピル、4- (5-s e c -ブチル-1-テトラゾリル) ブチル、5- (5-イソペンチル-1-テトラゾリル) ペンチル、6- (5-n-ヘキシル-1-テトラゾリル) ヘキシル基等のテトラゾール環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を有することがあり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるテトラゾリルアルキル基を例示できる。

【0097】

ベンゾチオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾチエニル低級アルキル基としては、[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチエニル] メチル、2- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチエニル] エチル、1- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-)] ベンゾチエニル] エチル、3- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-)] ベンゾチエニル] プロピル、4- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-)] ベンゾチエニル] ブチル、5- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-)] ベンゾチエニル] ペンチル、6- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-)] ベンゾチエニル] ヘキシル基等のベンゾチエニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を有することがあり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるベンゾチエニルアルキル基を例示できる。

6-又は7-) ベンゾチエニル] ヘキシル、1,1-ジメチル-2-[(2-,3-,4-、5-、6-又は7-) ベンゾチエニル] エチル、2-メチル-3-[(2-,3-,4-、5-、6-又は7-) ベンゾチエニル] プロピル、[5-クロロー(2-,3-,4-、6-又は7-) ベンゾチエニル] メチル、[4-プロモ-(2-,3-,5-,6-又は7-) ベンゾチエニル] メチル、[7-ヨード-(2-,3-,4-,5-又は6-) ベンゾチエニル] メチル、[2-クロロー(3-,4-,5-,6-又は7-) ベンゾチエニル] メチル、[4,5-ジクロロー(2-,3-,6-又は7-) ベンゾチエニル] メチル、[2,4,5-クロロー(3-,6-又は7-) ベンゾチエニル] エチル、1-[7-ヨード-(2-,3-,4-,5-又は6-) ベンゾチエニル] エチル、3-[2-クロロー(3-,4-,5-,6-又は7-) ベンゾチエニル] プロピル、4-[4,5-ジクロロー(2-,3-,6-又は7-) ベンゾチエニル] プチル、5-[2,4,5-トリクロロー(3-,6-又は7-) ベンゾチエニル] ペンチル、6-[5-クロロー(2-,3-,4-,6-又は7-) ベンゾチエニル] ヘキシル基等のベンゾチオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を1~3個有するがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるベンゾチエニルアルキル基を例示できる。

【0098】

低級アルキニル基としては、例えば、エチニル、2-プロピニル、2-ブチニル、3-ブチニルシ、1-メチル-2-プロピニル、2-ペンチニル、2-ヘキシニル基等の炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルキニル基を例示できる。

【0099】

低級アルケニル基としては、例えば、ビニル、1-プロペニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、2-プロペニル、2-ブテニル、1-ブテニル、3-ブテニル、2-ペンテニル、1-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1,3-ブタジエニル、1,3-ペンタジエニル、2-ペンテン-4-イニル、2-ヘキセニル、1-ヘキセニル、5-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、3,3-ジメチル-1-プロペニル、2-エチル-1-プロペニル、1,3,5-ヘキサトリエニル、1,3-ヘキサジエニル、1,4-ヘキサジエニル基等の二重結合を1~3個有する炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基を例示できる。

【0100】

ベンゾイミダゾリル低級アルキル基としては、例えば、[(1-,2-,4-又は5-) ベンゾイミダゾリル] メチル、2-[(1-,2-,4-又は5-) ベンゾイミダゾリル] エチル、1-[(1-,2-,4-又は5-) ベンゾイミダゾリル] エチル、3-[(1-,2-,4-又は5-) ベンゾイミダゾリル] プロピル、4-[(1-,2-,4-又は5-) ベンゾイミダゾリル] ブチル、5-[(1-,2-,4-又は5-) ベンゾイミダゾリル] ペンチル、6-[(1-,2-,4-又は5-) ベンゾイミダゾリル] ヘキシル、1,1-ジメチル-2-[(1-,2-,4-又は5-) ベンゾイミダゾリル] エチル、2-メチル-3-[(1,2,4-又は5-) ベンゾイミダゾリル] プロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるベンゾイミダゾリルアルキル基を例示できる。

【0101】

ピリジル低級アルキル基としては、例えば、[(2-,3-又は4-) ピリジル] メチル、2-[(2-,3-又は4-) ピリジル] エチル、1-[(2-,3-又は4-) ピリジル] エチル、3-[(2-,3-又は4-) ピリジル] プロピル、4-[(2-,3-又は4-) ピリジル] ブチル、1,1-ジメチル-2-[(2-,3-又は4-) ピリジル] エチル、5-[(2-,3-又は4-) ピリジル] ペンチル、6-[(2-,3-又は4-) ピリジル] ヘキシル、1-[(2-,3-又は4-) ピリジル] イソプロピル、2-メチル-3-[(2-,3-又は4-) ピリジル] プロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基を例示できる。

【0102】

イミダゾール環上に置換基としてフェニル低級アルキル基を有することのあるイミダゾール低級アルキル基としては、例えば、[(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、2- [(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] エチル、1- [(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] エチル、3- [(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] プロピル、4- [(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] ブチル、1, 1-ジメチル-2- [(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] エチル、5- [(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] ペンチル、6- [(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] ヘキシル、1- [(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] イソプロピル、2-メチル-3- [(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] プロピル、[1-ペンジル- (2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、[1- (1-フェニルエチル) - (2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、[1- (1-フェニルエチル) - (2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、[1- (3-フェニルプロピル) - (2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、[1- (4-フェニルブチル) - (2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、[1- (5-フェニルペンチル) - (2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、[1- (6-フェニルヘキシル) - (2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、2- [2-ペンジル- (1-、4-又は5-) イミダゾリル] エチル、1- [4- (4-フェニルエチル) - (1-又は2-) イミダゾリル] エチル、3- [2- (2-フェニルエチル) - (1-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、4- [1- (3-フェニルプロピル) - (2-、4-又は5-) イミダゾリル] ブチル、5- [1- (4-フェニルブチル) - (2-、4-又は5-) イミダゾリル] ペンチル、6- [1- (5-フェニルペンチル) - (2-、4-又は5-) イミダゾリル] ヘキシル、[1, 2-ジベンジル- (4-又は5-) イミダゾリル] メチル、(1, 2, 4-トリベンジル-5-イミダゾリル) メチル基等のイミダゾール環上に置換基として、前記例示のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を1～3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるイミダゾリルアルキル基を例示できる。

【0103】

ハロゲン原子を有することのある低級アルキルスルホニル基としては、例えば、前記低級アルキルスルホニル基に加えて、トリフルオロメチルスルホニル、トリクロロメチルスルホニル、クロロメチルスルホニル、プロモメチルスルホニル、フルオロメチルスルホニル、ヨードメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、ジブロモメチルスルホニル、2-クロロエチルスルホニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル、2, 2, 2-トリクロロエチルスルホニル、3-クロロプロピルスルホニル、2, 3-ジクロロプロピルスルホニル、4, 4, 4-トリクロロブチルスルホニル、4-フルオロブチルスルホニル、5-クロロペンチルスルホニル、3-クロロ-2-メチルプロピルスルホニル、5-ブロモヘキシルスルホニル、5, 6-ジブロモヘキシルスルホニル基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基を例示できる。

【0104】

ハロゲン原子を有することのあるアルコキシカルボニル基としては、例えば、前記低級アルコキシカルボニル基に加えて、n-ヘプチルオキシカルボニル、n-オクチルオキシカルボニル、n-ノニルオキシカルボニル、n-デシルオキシカルボニル、2-エチルヘキシルオキシカルボニル、トリフルオロメトキシカルボニル、トリクロロメトキシカルボニル、クロロメトキシカルボニル、プロモメトキシカルボニル、フルオロメトキシカルボニル、ヨードメトキシカルボニル、ジフルオロメトキシカルボニル、ジブロモメトキシカルボニル、2-クロロエトキシカルボニル、2-フルオロエトキシカルボニル、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル、3-クロロプロポキシカルボニル、2, 3-ジクロロプロポキシカルボニル、4, 4, 4-トリクロロブロキシカルボニル、4-フルオロブロキシカルボニル、4-クロロブロキシカルボニル、

カルボニル、5-クロロペンチルオキシカルボニル、3-クロロー-2-メチルプロポキシカルボニル、5-ブロモヘキシルオキシカルボニル、5, 6-ジブロモヘキシルオキシカルボニル、7, 7, 6-トリクロロヘプチルオキシカルボニル、8-ブロモオクチルオキシカルボニル、9, 9, 9-トリフルオロノニルオキシカルボニル、10, 10, 10-トリクロロデシルオキシカルボニル基等の置換基としてハロゲン原子を1~3個有するとのあるアルコキシ部分の炭素数1~10の直鎖又は分枝鎖状アルコキシであるアルコキシカルボニル基を例示できる。

【0105】

ピリジン環上に置換基としてピロリル基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基としては、例えば、(2-、3-又は4-)ピリジルカルボニル、2-クロロー-(3-、4-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、2, 6-ジクロロー-(3-、4-又は5-)ピリジルカルボニル、2-(1-ピロリル)- (3-、4-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、2-ブロモ-(3-、4-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、2, 6-ジフルオロー-(3-、4-又は5-)ピリジルカルボニル、4-(1-ピロリル)- (2-、3-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、2, 5-ジブロモ-(3-、4-又は6-)ピリジルカルボニル、2-(1-ピロリル)-4-クロロー-(3-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、2, 4, 6-トリフルオロー-(3-又は5-)ピリジルカルボニル、2, 4-ジ(1-ピロリル)- (3-、5-又は6-)ピリジルカルボニル基等のピリジン環上に置換基としてピロリル基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基を1~3個有することのあるピリジルカルボニル基を例示できる。

【0106】

ピリジン環上に置換基として低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるピリジル基としては、例えば、(2-、3-又は4-)ピリジル、2-メチル-(3-、4-、5-又は6-)ピリジル、3-メチル-(2-、4-、5-又は6-)ピリジル、2-メトキシー-(3-、4-、5-又は6-)ピリジル、4-エチル-(2-又は3-)ピリジル、3-n-プロピル-(2-、4-、5-又は6-)ピリジル、2-n-ペンチル-(3-、4-、5-又は6-)ピリジル、3-n-ヘキシル-(2-、4-、5-又は6-)ピリジル、2, 4-ジメチル-(3-、5-又は6-)ピリジル、2, 4, 6-トリメチル-(3-又は5-)ピリジル、3-エトキシー-(2-、4-、5-又は6-)ピリジル、2-イソプロポキシー-(3-、4-、5-又は6-)ピリジル、2-n-ブトキシー-(3-、4-、5-又は6-)ピリジル、4-n-ペンチルオキシー-(2-又は3-)ピリジル、2-n-ヘキシルオキシー-(3-、4-、5-又は6-)ピリジル、2, 3-ジメトキシー-(4-、5-又は6-)ピリジル、3-m, 5-トリメトキシー-(2-又は6-)ピリジル、2-メチル-3-メトキシー-(4-、5-又は6-)ピリジル基等のピリジン環上に置換基として前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるピリジル基を例示できる。

【0107】

低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、n-ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、n-ペンチルアミノ、n-ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジ-n-プロピルアミノ、ジ-n-ブチルアミノ、ジ-n-ペンチルアミノ、ジ-n-ヘキシルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-エチル-N-n-プロピルアミノ、N-メチル-N-n-ブチルアミノ、N-メチル-N-n-ヘキシルアミノ、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ペントノイルアミノ、tert-ブチルカルボニルアミノ、ヘキサノイルアミノ、N, N-ジアセチルアミノ、N-アセチ

ルーN-プロピオニルアミノ、N-メチル-N-アセチルアミノ、N-エチル-N-プロピオニルアミノ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群から選ばれた基を1～2個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0108】

ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基とては、例えば、(1-、2-又は3-)ピロリジニル、2-オキソ-(1-、3-、4-又は5-)ピロリジニル、2, 5-ジオキソ-(1-又は3-)ピロリジニル基等のピロリジン環上に置換基としてオキソ基を1～2個を有することのあるピロリジニル基を例示できる。

【0109】

ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル基とては、例えば、(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニル、1-メチル-(2-、3-又は4-)ピペリジニル、1-エチル-(2-、3-又は4-)ピペリジニル、1-n-プロピル-(2-、3-又は4-)ピペリジニル、1-イソプロピル-(2-、3-又は4-)ピペリジニル、1-n-ブチル-(2-、3-又は4-)ピペリジニル、1-n-ヘキシル-(2-、3-又は4-)ピペリジニル、1, 2-ジメチル-(3-、4-、5-又は6-)ピペリジニル、1, 2, 3-トリメチル-(4-、5-又は6-)ピペリジニル、2-n-プロピル-(1-、3-、4-、5-又は6-)ピペリジニル、3-エチル-(1-、2-、4-、5-又は6-)ピペリジニル、2-メチル-4-イソプロピル-(1-、3-、5-又は6-)ピペリジンル基等のピペリジン環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基を1～3個有することのあるピペリジニル基を例示できる。

【0110】

低級アルキル基を有することのあるカルバモイル基とては、例えば、カルバモイル、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、n-プロピルカルバモイル、イソプロピルカルバモイル、n-ブチルカルバモイル、tert-ブチルカルバモイル、n-ペンチルカルバモイル、n-ヘキシルカルバモイル、ジメチルカルバモイル、ジエチルカルバモイル、ジ-n-プロピルカルバモイル、ジ-n-ブチルカルバモイル、ジ-n-ペンチルカルバモイル、ジ-n-ヘキシルカルバモイル、N-メチル-N-エチルカルバモイル、N-エチル-N-n-プロピルカルバモイル、N-メチル-N-n-ブチルカルバモイル、N-メチル-N-n-ヘキシルカルバモイル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるカルバモイル基を例示できる。

【0111】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子；ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基；フェノキシ基；ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基；低級アルキルチオ基；低級アルキルスルホニル基；低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基；ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基；ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル基；低級アルケニル基；アミノスルホニル基；水酸基；低級アルキル基を有することのあるカルバモイル基；フェニル低級アルコキシ基及びシアノ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル基とては、例えば、フェニル、4-フェノキシフェニル、3-フェノキシフェニル、2-フェノキシフェニル、4-イソプロピルフェニル、3-イソプロピルフェニル、2-イソプロピルフェニル、4-tert-ブチルフェニル、4-メチルフェニル、3-メチルフェニル、2-メチルフェニル、2, 3-ジメチルフェニル、2, 4-ジメチルフェニル、3, 5-ジメチルフェニル、2, 4, 6-トリメチルフェニル、4-メチル-3-メトキシフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、4-メチル-3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、3-クロロフェニル、2-クロロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、3-プロモフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、3, 4, 5-トリク

ロロフェニル、2, 4, 6-トリフルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、2-クロロ-5-フルオロフェニル、3-フルオロ-4-メトキシフェニル、3-クロロ-4-メトキシフェニル、3-クロロ-4-ヒドロキシフェニル、4-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、2-メトキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、2, 4, 6-トリメトキシフェニル、2-メトキシ-5-クロロフェニル、2-メトキシ-5-アセチルアミノフェニル、2-クロロ-5-アセチルアミノフェニル、4-エトキシフェニル、4-トリフルオロメトキシフェニル、3-トリフルオロメトキシフェニル、2-トリフルオロメトキシフェニル、3-メトキシ-5-トリフルオロメチルフェニル、4-メチルチオフェニル、3-メチルチオフェニル、2-メチルチオフェニル、2-(1-メチル-1-ビニル)フェニル、4-ビニルフェニル、3-ジメチルアミノフェニル、4-メチルアミノフェニル、2-(N-メチル-N-アセチルアミノ)フェニル、3-アセチルアミノフェニル、4-プロピオニルアミノフェニル、4-アセチルアミノフェニル、2-アセチルアミノフェニル、4-アミノスルホニルフェニル、3-アミノスルホニルフェニル、2-アミノスルホニルフェニル、4-メチルチオフェニル、3-メチルチオフェニル、2-メチルチオフェニル、4-メチルスルホニルフェニル、3-メチルスルホニルフェニル、2-メチルスルホニルフェニル、4-メチルカルバモイルフェニル、3-カルバモイルフェニル、2-エチルカルバモイルフェニル、2-ベンジルオキシフェニル、3-ベンジルオキシフェニル、4-ベンジルオキシフェニル、2-フェニルフェニル、3-フェニルフェニル、4-フェニルフェニル、2-シアノフェニル、3-シアノフェニル、4-シアノフェニル、4-[2-オキソ-(1-, 3-, 4-又は5-)ピロリジニル]フェニル、3-[2, 5-ジオキソ-(1-又は3-)ピロリジニル]フェニル、4-[4-メチル-(1-, 2-又は3-)ピペラジニル]フェニル、3-[4-エチル-(1-, 2-又は3-)ピペラジニル]フェニル、2-[4-イソプロピル-(1-, 2-又は3-)ピペラジニル]フェニル基等のフェニル環上に置換基として前記例示のハロゲン原子；前記例示のハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基；フェノキシ基；前記例示のハロゲン原子1~3個を有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基；前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基；前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群から選ばれた基を1~2個有することのあるアミノ基；前記例示のピロリジン環上に置換基としてオキソ基を1~2個有することのあるピロリジニル基；前記例示のピペリジン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することのあるピペリジニル基；前記例示の二重結合を1~3個有する炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基；アミノスルホニル基；水酸基；前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基1~2個を有することのあるカルバモイル基；前記例示のアルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基及びシアノ基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0112】

シクロアルキル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるシクロアルキル基としては、例えば、前記シクロアルキル基に加えて、1-メチルシクロプロピル、1-メチルシクロペンチル、1-メチルシクロヘキシル、2-メチルシクロヘキシル、1-メチルシクロブチル、1-エチルシクロオクチル、1-n-プロピルシクロヘプチル、1, 2-ジメチルシクロヘキシル、1, 4, 5-トリメチルシクロオクチル、1-n-ブチルシクロプロピル、1-n-ペンチルシクロペンチル、1-n-ヘキシルシクロヘキシル基等のシクロアルキル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することのある炭素数3~8のシクロアルキル基を例示できる。

【0113】

低級アルキル基及びフェニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、イソプロピ

ルアミノ、n-アーピチルアミノ、tert-アーピチルアミノ、n-ペンチルアミノ、n-ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジ-n-プロピルアミノ、ジ-n-アーピチルアミノ、ジ-n-ペンチルアミノ、ジ-n-ヘキシルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-エチル-N-n-プロピルアミノ、N-メチル-N-n-アーピチルアミノ、N-メチル-N-n-ヘキシルアミノ、フェニルアミノ、N,N-ジフェニルアミノ、N-メチル-N-フェニルアミノ、N-エチル-N-フェニルアミノ、N-n-プロピル-N-フェニルアミノ基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びフェニル基なる群より選ばれた基を1～2個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0114】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子；フェノキシ基；フェニル基；ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基；低級アルコキシ基；低級アルカノイル基；ニトロ基；シアノ基；低級アルキル基及びフェニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基；ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基；ピロリル基；ピラゾリル基；1, 2, 4-トリアゾリル基及びイミダゾリル基なる群から選ばれた基を有することのあるベンゾイル基としては、例えば、ベンゾイル、4-メトキシベンゾイル、3-メトキシベンゾイル、2-メトキシベンゾイル、2, 4-ジメトキシベンゾイル、3, 4, 5-トリメトキシベンゾイル、2-メトキシ-5-クロロベンゾイル、4-フェノキシベンゾイル、2-フェノキシベンゾイル、3-フェノキシベンゾイル、4-クロロベンゾイル、3-クロロベンゾイル、2-クロロベンゾイル、2, 6-ジクロロベンゾイル、2-クロロ-4-フルオロベンゾイル、2, 4, 6-トリフルオロベンゾイル、4-プロモベンゾイル、3-フルオロベンゾイル、4-トリフルオロメチルベンゾイル、3-トリフルオロメチルベンゾイル、2-トリフルオロメチルベンゾイル、3-フルオロ-2-メチルベンゾイル、4-メチルベンゾイル、3-メチルベンゾイル、2-メチルベンゾイル、3, 4-ジメチルベンゾイル、2, 4, 5-トリメチルベンゾイル、2-フェニルベンゾイル、3-フェニルベンゾイル、4-フェニルベンゾイル、4-ニトロベンゾイル、3-ニトロベンゾイル、2-ニトロベンゾイル、2-ジメチルアミノベンゾイル、3-メチルアミノベンゾイル、4-(N-メチルアニリノ)ベンゾイル、2-アニリノベンゾイル、3-シアノベンゾイル、4-シアノベンゾイル、2-シアノベンゾイル、4-アセチルベンゾイル、2-プロピオニルベンゾイル、3-ブチリルベンゾイル、4-[(1-, 2-又は3-) ピロリル]ベンゾイル、4-[(1-, 3-, 4-又は5-) ピラゾリル]ベンゾイル、4-[(1-, 3-又は5-) 1, 2, 4-トリアゾリル]ベンゾイル、4-[(1-, 2-, 4-又は5-) イミダゾリル]ベンゾイル、4-[2-オキソ-(1-, 3-, 4-又は5-) ピロリジニル]ベンゾイル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子；フェノキシ基；フェニル基；前記例示のハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基；前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基；前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基；ニトロ基；シアノ基；前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びフェニル基なる群より選ばれた基を1～2個有することのあるアミノ基；前記例示のピロリジン環上に置換基としてオキソ基を1～2個有することのあるピロリジニル基；ピロリル基；ピラゾリル基；1, 2, 4-トリアゾリル基及びイミダゾリル基なる群から選ばれた基を1～3個有することのあるベンゾイル基を例示できる。

【0115】

低級アルキレンジオキシ基としては、例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリメチレンジオキシ、テトラメチレンジオキシ基等の炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖状のアルキレン基を例示できる。

【0116】

フェニル環上に低級アルキレンジオキシ基を有するベンゾイル基としては、例えば、3, 4-メチレンジオキシベンゾイル、2, 3-エチレンジオキシベンゾイル、3, 4-トリメチレンジオキシベンゾイル、2, 3-テトラメチレンジオキシベンゾイル基等のフェニル環上に前記例示の炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖状のアルキレンジオキシ基を有する

ベンゾイル基を例示できる。

【0117】

シクロアルキルカルボニル基としては、例えばシクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘプチルカルボニル、シクロオクチルカルボニル基等のシクロアルキル部分が炭素数3～8のシクロアルキル基であるシクロアルキルカルボニル基を挙げることができる。

【0118】

フリルカルボニル基としては、例えば、(2-又は3-)フリルカルボニル基を例示できる。

【0119】

ナフチルカルボニル基としては、例えば、(1-又は2-)ナフチルカルボニル基を例示できる。

【0120】

フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、低級アルキル基、ハロゲン原子及びニトロ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェノキシカルボニル基としては、例えば、フェノキシカルボニル、4-クロロフェノキシカルボニル、3-クロロフェノキシカルボニル、2-クロロフェノキシカルボニル、3, 4-ジクロロフェノキシカルボニル、2, 4, 6-トリクロロフェノキシカルボニル、4-フルオロフェノキシカルボニル、3-フルオロフェノキシカルボニル、2-フルオロフェノキシカルボニル、2, 4-ジフルオロフェノキシカルボニル、3, 4, 5-トリフルオロフェノキシカルボニル、4-プロモフェノキシカルボニル、2-クロロ-4-メトキシフェノキシカルボニル、3-フルオロ-5-メチルフェノキシカルボニル、4-メトキシフェノキシカルボニル、3-メトキシフェノキシカルボニル、2-メトキシフェノキシカルボニル、3, 4-ジメトキシフェノキシカルボニル、2, 4, 5-トリメトキシフェノキシカルボニル、4-メチルフェノキシカルボニル、3-メチルフェノキシカルボニル、2-メチルフェノキシカルボニル、2, 3, 4-ジメチルフェノキシカルボニル、4-ニトロフェノキシカルボニル、3-ニトロフェノキシカルボニル、2-ニトロフェノキシカルボニル、2, 4-ジニトロフェノキシカルボニル、2, 4, 6-トリニトロフェノキシカルボニル基等のフェニル環上に置換基として前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、ハロゲン原子及びニトロ基なる群から選ばれた基を1～3個有することのあるフェノキシカルボニル基を例示できる。

【0121】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子及びニトロ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル、2-フェニルエトキシカルボニル、1-フェニルエトキシカルボニル、3-フェニルプロポキシカルボニル、4-フェニルブロキシカルボニル、5-フェニルペンチルオキシカルボニル、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシカルボニル、2-メチル-3-フェニルプロポキシカルボニル、2-クロロベンジルオキシカルボニル、3-クロロベンジルオキシカルボニル、2-クロロベンジルオキシカルボニル、3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル、4-フルオロベンジルオキシカルボニル、3-フルオロベンジルオキシカルボニル、2-フルオロベンジルオキシカルボニル、2, 4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル、4-プロモベンジルオキシカルボニル、4-ニトロベンジルオキシカルボニル、3-ニトロベンジルオキシカルボニル、2-ニトロベンジルオキシカルボニル、2, 4-ジニトロベンジルオキシカルボニル、2, 4, 6-トリニトロベンジルオキシカルボニル、2-ニトロ-4-クロロベンジルオキシカルボニル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子及びニトロ基なる群より選ばれた基を1～3個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシカルボ

ニル基を挙げることができる。

【0122】

ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基（フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい）及びフェニル基（フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよい）なる群から選ばれた基を有することのあるピペリジニル基としては、例えば、（1-、2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-メチル-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-アセチル-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-ベンゾイル-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-（4-クロロベンゾイル）-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-（3-プロモベンゾイル）-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-ベンゾイル-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-（4-フルオロベンゾイル）-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-（2、4-ジクロロベンゾイル）-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-（2、4、6-トリフルオロベンゾイル）-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、2-（3-クロロベンゾイル）-（1-、3-又は4-）ピペリジニル、3-（2-クロロベンゾイル）-（1-、2-又は4-）ピペリジニル、4-（2、3-ジプロモベンゾイル）-（1-、2-又は3-）ピペリジニル、1、2-ジベンゾイル-（3-又は4-）ピペリジニル、1、2、4-トリベンゾイル-3-ピペリジニル、1、4-ジメチル-（2-、3-、5-又は6-）ピペリジニル、1-ベンゾイル-2-メチル-（3-、4-、5-又は6-）ピペリジニル、1-フェニル-2-メチル-（3-、4-、5-又は6-）ピペリジニル、1-アセチル-3-メチル-（2-、4-、5-又は6-）ピペリジニル、1-フェニル-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-（4-クロロフェニル）-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-（3-プロモフェニル）-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-フェニル-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-（4-フルオロフェニル）-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-（2、4-ジクロロフェニル）-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、1-（2、4、6-トリフルオロフェニル）-（2-、3-又は4-）ピペリジニル、2-（3-クロロフェニル）-（1-、3-、4-、5-又は6-）ピペリジニル、3-（2-クロロフェニル）-（1-、2-、4-、5-又は6-）ピペリジニル、4-（2、3-ジプロモフェニル）-（1-、2-又は3-）ピペリジニル、1、2-ジフェニル-（3-、4-、5-又は6-）ピペリジニル、1、2、4-トリフェニル-（3-、5-又は6-）ピペリジニル基等のピペリジン環上に置換基として、前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基、前記例示のベンゾイル基（フェニル環上にハロゲン原子が1～3個置換していてもよい）及び前記例示のフェニル基（フェニル環上にハロゲン原子が1～3個置換していてもよい）なる群から選ばれた基を1～3個有することのあるピペリジニル基を例示できる。

【0123】

テトラヒドロピラニル低級アルキル基としては、例えば、[（2-、3-又は4-）テトラヒドロピラニル]メチル、2-[（2-、3-又は4-）テトラヒドロピラニル]エチル、1-[（2-、3-又は4-）テトラヒドロピラニル]エチル、3-[（2-、3-又は4-）テトラヒドロピラニル]プロピル、4-[（2-、3-又は4-）テトラヒドロピラニル]ブチル、1,1-ジメチル-2-[（2-、3-又は4-）テトラヒドロピラニル]エチル、5-[（2-、3-又は4-）テトラヒドロピラニル]ペンチル、6-[（2-、3-又は4-）テトラヒドロピラニル]ヘキシル、1-[（2-、3-又は4-）テトラヒドロピラニル]イソプロピル、2-メチル-3-[（2-、3-又は4-）テトラヒドロピラニル]プロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるテトラヒドロピラニルアルキル基を例示できる。

【0124】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び水酸基なる群から選ばれ

た基を有することがあり、又低級アルキル基上に低級アルコキシカルボニル基を有するとのあるフェニル低級アルキル基としては、例えば、ベンジル、1-フェネチル、2-フェネチル、3-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、1, 1-ジメチル-1-フェニルメチル、1, 1-ジフェニルメチル、2, 2-ジフェニルエチル、3, 3-ジフェニルプロピル、1, 2-ジフェニルエチル、4-クロロベンジル、2-クロロベンジル、3-クロロベンジル、3-フルオロベンジル、4-フルオロベンジル、3-ブロモベンジル、2, 3-ジクロロベンジル、2, 6-ジクロロベンジル、2, 4, 6-トリフルオロベンジル、2-(4-クロロフェニル)エチル、2-(2-フルオロフェニル)エチル、2-(3-フルオロフェニル)エチル、3-トリフルオロメチルベンジル、4-トリフルオロメチルベンジル、2-メチルベンジル、3-メチルベンジル、4-メチルベンジル、4-tert-ブチルベンジル、2, 4-ジメチルベンジル、2, 4, 6-トリメチルベンジル、2-トリフルオロメトキシベンジル、3-トリフルオロメトキシベンジル、4-トリフルオロメトキシベンジル、2-メトキシベンジル、3-メトキシベンジル、4-メトキシベンジル、4-エトキシベンジル、2-(3-メトキシフェニル)エチル、3, 4-ジメトキシベンジル、3, 4, 5-トリメトキシベンジル、4-ヒドロキシベンジル、3-ヒドロキシベンジル、2-ヒドロキシベンジル、2, 4-ジヒドロキシベンジル、3, 4, 5-トリヒドロキシベンジル、2-メトキシ-4-クロロベンジル、3-メチル-5-フルオロベンジル、2-(4-ヒドロキシフェニル)-1-メトキシカルボニルエチル、2-(4-クロロフェニル)-1-エトキシカルボニルエチル基等のフェニル環上に置換基として、ハロゲン原子、前記例示のハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、前記例示のハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基及び水酸基なる群から選ばれた基を1~3個有することがあるフェニル基を1~2個有し、アルキル基上にアルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアルコキシカルボニル基を有することのある、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

【0125】

低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル低級アルキル基としては、例えば、3, 4-メチレンジオキシベンジル、3, 4-トリメチレンジオキシベンジル、2-(2, 3-エチレンジオキシフェニル)エチル、1-(3, 4-トリメチレンジオキシフェニル)エチル、3-(2, 3-テトラメチレンジオキシフェニル)プロピル、4-(3, 4-メチレンジオキシフェニル)ブチル、5-(2, 3-エチレンジオキシフェニル)ペンチル、6-(3, 4-トリメチレンジオキシフェニル)ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-(2, 3-メチレンジオキシフェニル)エチル、2-メチル-3-(3, 4-エチレンジオキシフェニル)プロピル基等のフェニル環上に置換基として前記例示の炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基を有し、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

【0126】

フリル低級アルキル基としては、例えば、[(2-又は3-)フリル]メチル、2-[(2-又は3-)フリル]エチル、1-[(2-又は3-)フリル]エチル、3-[(2-又は3-)フリル]プロピル、4-[(2-又は3-)フリル]ブチル、5-[(2-又は3-)フリル]ペンチル、6-[(2-又は3-)フリル]ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(2-又は3-)フリル]エチル、2-メチル-3-[(2-又は3-)フリル]プロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフリルアルキル基を例示できる。

【0127】

低級アルキル基及びフェニル基(フェニル環上に低級アルキル基が置換していてもよい)なる群から選ばれた基を有することのあるカルバモイル低級アルキル基としては、例え

ば、カルバモイルメチル、2-カルバモイルエチル、1-カルバモイルエチル、3-カルバモイルプロピル、4-カルバモイルブチル、5-カルバモイルペンチル、6-カルバモイルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-カルバモイルエチル、2-メチル-3-カルバモイルプロピル、2-(N-メチル-N-フェニルカルバモイル)エチル、N-(4-メチルフェニル)カルバモイルメチル、2-[N-メチル-N-(3-メチルフェニル)カルバモイル]エチル、N-(2-メチルフェニル)カルバモイルメチル、2-[N-エチル-N-(3, 4-ジメチルフェニル)カルバモイル]エチル、N-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)カルバモイルメチル、N,N-ジメチルカルバモイルメチル、N-メチル-N-エチルカルバモイルメチル、N-メチルカルバモイルメチル、2-(N-メチルカルバモイル)エチル基等の前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び前記例示のフェニル基(フェニル環上に炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基が1~3個置換していてもよい)なる群から選ばれた基を1~2個有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるカルバモイルアルキル基を例示できる。

【0128】

低級アルキル基上にカルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基なる群から選ばれた基を有することのあるイミダゾリル低級アルキル基としては、例えば、前記イミダゾリル低級アルキル基に加えて、1-カルバモイル-2-[(1-, 2-, 4-又は5-) イミダゾリル]エチル、1-メトキシカルボニル-2-[(1-, 2-, 4-又は5-) イミダゾリル]エチル、1-カルバモイル-1-[(1-, 2-, 4-又は5-) イミダゾリル]メチル、1-エトキシカルボニル-1-[(1-, 2-, 4-又は5-) イミダゾリル]メチル、1-カルバモイル-3-[(1-, 2-, 4-又は5-) イミダゾリル]プロピル、1-n-ブロポキシカルボニル-4-[(1-, 2-, 4-又は5-) イミダゾリル]ブチル、1-カルバモイル-5-[(1-, 2-, 4-又は5-) イミダゾリル]ペンチル、1-tert-ブトキシカルボニル-6-[(1-, 2-, 4-又は5-) イミダゾリル]ヘキシル基等のアルキル基上にカルバモイル基及びアルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアルコキシカルボニル基なる群から選ばれた基を有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるイミダゾリルアルキル基を例示できる。

【0129】

低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基としては、例えば、アミノメチル、2-アミノプロピル、1-アミノエチル、3-アミノプロピル、4-アミノブチル、5-アミノペンチル、6-アミノヘキシル、1, 1-ジメチル-2-アミノエチル、2-メチル-3-アミノプロピル、メチルアミノメチル、2-エチルアミノエチル、3-n-ブロピルアミノプロピル、3-イソブロピルアミノプロピル、4-n-ブチルアミノブチル、5-n-ペンチルアミノペンチル、6-n-ヘキシルアミノヘキシル、ジメチルアミノエチル、2-ジイソブロピルアミノブロピル、3-ジイソブロピルアミノブロピル、(N-エチル-N-n-ブロピルアミノ)メチル、2-(N-メチル-N-n-ヘキシルアミノ)メチル基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を有する、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0130】

2, 3, 4, 5-テトラヒドロフラン環上に置換基としてオキソ基を有することのある2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル基としては、例えば、(2-又は3-)2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル、2-オキソ-(3-, 4-, 又は5-)2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル、3-オキソ-(2-, 4-, 又は5-)2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル、2, 5-ジオキソ-(3-又は4-)2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル基等の2, 3, 4, 5-テトラヒドロフラン環上に置換基としてオキソ基を1~2個有することのある2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル基を例示できる。

【0131】

ピロリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピロリジニル低級アルキル基としては、例えば、[(1-、2-又は3-)ピロリジニル]メチル、2-[(1-、2-又は3-)ピロリジニル]エチル、1-[(1-、2-又は3-)ピロリジニル]エチル、3-[(1-、2-又は3-)ピロリジニル]プロピル、4-[(1-、2-又は3-)ピロリジニル]ブチル、5-[(1-、2-又は3-)ピロリジニル]ペンチル、6-[(1-、2-又は3-)ピロリジニル]ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(1-、2-又は3-)ピロリジニル]エチル、2-メチル-3-[(1-、2-又は3-)ピロリジニル]ブロピル、1-エチル-[(2-又は3-)ピロリジニル]メチル、1-エチル-[(2-又は3-)ピロリジニル]メチル、2-メチル-[(1-、3-、4-又は5-)ピロリジニル]メチル、3-n-ブロピル-[(1-、2-、4-又は5-)ピロリジニル]メチル、1-n-ブチル-[(2-又は3-)ピロリジニル]メチル、2-n-ペンチル-[(1-、3-、4-又は5-)ピロリジニル]メチル、1-n-ヘキシル-[(2-又は3-)ピロリジニル]メチル、(1, 2-ジメチル-(3-、4-又は5-ピロリジニル)メチル、1, 2, 3-トリメチル-[(4-又は5-)ピロリジニル]メチル基等のピロリジン環上に置換基として前記記載の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基1～3個を有することがあり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピロリジニルアルキル基を例示できる。

【0132】

フェノキシ低級アルカノイル基としては、例えば、2-フェノキシアセチル、3-フェノキシプロピオニル、2-フェノキシプロピオニル、4-フェノキシブチリル、5-フェノキシペンタノイル、6-フェノキシヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-フェノキシプロピオニル、2-メチル-3-フェノキシプロピオニル基等のアルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるフェノキシアルカノイル基を例示できる。

【0133】

モルホリノ低級アルキル基としては、例えば、[(2-、3-又は4-)モルホリノ]メチル、2-[(2-、3-又は4-)モルホリノ]エチル、1-[(2-、3-又は4-)モルホリノ]エチル、3-[(2-、3-又は4-)モルホリノ]ブロピル、4-[(2-、3-又は4-)モルホリノ]ブチル、5-[(2-、3-又は4-)モルホリノ]ペンチル、6-[(2-、3-又は4-)モルホリノ]ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(2-、3-又は4-)モルホリノ]エチル、2-メチル-3-[(2-、3-又は4-)モルホリノ]ブロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるモルホリノアルキル基を例示できる。

【0134】

ピリジル低級アルカノイル基としては、例えば、2-[(2-, 3-又は4-)ピリジル]アセチル、3-[(2-, 3-又は4-)ピリジル]ブロピオニル、2-[(2-, 3-又は4-)ピリジル]ブロピオニル、4-[(2-, 3-又は4-)ピリジル]ブチリル、5-[(2-, 3-又は4-)ピリジル]ペンタノイル、6-[(2-, 3-又は4-)ピリジル]ヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-[(2-, 3-又は4-)ピリジル]ブロピオニル、2-メチル-3-[(2-, 3-又は4-)ピリジル]ブロピオニル基等のアルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるピリジルアルカノイル基を例示できる。

【0135】

チエニルカルボニル基としては、例えば、2-チエニルカルボニル、3-チエニルカルボニル基等を例示できる。

【0136】

チエニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-[(2-又は3-)チエニル]アセチル、3-[(2-又は3-)チエニル]ブロピオニル、2-[(2-又は3-)チエニル]ブロピオニル、4-[(2-又は3-)チエニル]ブチリル、5-[(2-又は3-)チエニル]ペンタノイル、6-[(2-又は3-)チエニル]ヘキサノイル、2, 2-

—ジメチル-3-[（2-又は3-）チエニル]プロピオニル、2-メチル-3-[（2-又は3-）チエニル]プロピオニル基等のアルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるチエニルアルカノイル基を例示できる。

【0137】

シクロアルキル低級アルカノイル基としては、例えば、2-シクロプロピルアセチル、2-シクロヘキシリカルボニル、3-シクロプロピルプロピオニル、2-シクロブチルプロピオニル、2-シクロペンチルアセチル、3-シクロペンチルプロピオニル、4-シクロヘキシリカルボニル、5-シクロヘプチルペントノイル、6-シクロオクチルヘキサノイル、2,2-ジメチル-3-シクロヘキシリカルボニル、2-メチル-3-シクロプロピルプロピオニル基等のアルキル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である炭素数3～8のシクロアルキルアルキル基を挙げることができる。

【0138】

イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリルカルボニル基としては、例えば、（3-、4-又は5-）イソオキサゾリルカルボニル、[3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリル]カルボニル、[3-エチル-（4-又は5-）イソオキサゾリル]カルボニル、[4-n-プロピル-（3-又は5-）イソオキサゾリル]カルボニル、[5-n-ブチル-（3-又は4-）イソオキサゾリル]カルボニル、[3-n-ペンチル-（4-又は5-）イソオキサゾリル]カルボニル、[4-n-ヘキシル-（3-又は5-）イソオキサゾリル]カルボニル基等のイソオキサゾール環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるイソオキサゾリルカルボニル基を例示できる。

【0139】

ピラジルカルボニル基としては、例えば、2-ピラジルカルボニル基等を例示できる。

【0140】

ピペリジン環上に置換基としてベンゾイル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるピペリジニルカルボニル基としては、例えば、

(1-、2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、[1-アセチル-（2-、3-又は4-）ピペリジニル]カルボニル、[1-ベンゾイル-（2-、3-又は4-）ピペリジニル]カルボニル、[2-プロピオニル-（1-、3-、5-又は6-）ピペリジニル]カルボニル、[3-ブチリル-（1-、2-、5-又は6-）ピペリジニル]カルボニル、[4-ペントノイル-（1-、2-又は3-）ピペリジニル]カルボニル、[1-ヘキサノイル-（2-、3-又は4-）ピペリジニル]カルボニル、[1-アセチル-4-ベンゾイル-（2-、3-、5-又は6-）ピペリジニル]カルボニル、[1,2,4-トリアセチル-（3-、5-又は6-）ピペリジニル]カルボニル基等のピペリジン環上に置換基としてベンゾイル基及び前記記載の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるピペリジニルカルボニル基を例示できる。

【0141】

クロマニルカルボニル基としては、例えば、2-クロマニルカルボニル、3-クロマニルカルボニル、4-クロマニルカルボニル、5-クロマニルカルボニル、6-クロマニルカルボニル、7-クロマニルカルボニル、8-クロマニルカルボニル基等を例示できる。

【0142】

イソインドリン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるイソインドリニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-[（1-、2-、4-又は5-）イソインドリニル]アセチル、3-[（1-、2-、4-又は5-）イソインドリニル]プロピオニル、2-[（1-、2-、4-又は5-）イソインドリニル]プロピオニル、4-[（1-、2-、4-又は5-）イソインドリニル]ブチリル、5-[（1-、2-、4-又は5-）イソインドリニル]ペントノイル、6-[（1-、2-、4-又は5-）イソインドリニル]ヘキサノイル、2,2-ジメチル-3-[（1-、2-、4-又は5-）イソインドリニル]プロピオニル、2-メチル-3-[（1-、2-、4-又は5-）イソインド

リニル] プロピオニル、[1, 3-ジオキソ-2-(2-、4-又は5-) イソインドリニル] アセチル、[1-オキソ-2-(2-、3-、4-、5-、6-又は7-) イソインドリニル] アセチル基等のイソインドリン環上に置換基としてオキソ基を1~2個有することがあり、アルカノイル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるイソインドリニルアルカノイル基を例示できる。

【0143】

チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基及びチオオキソ基なる群より選ばれた基を有することのあるチアゾリジニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-[(2-、3-、4-又は5-) チアゾリジニル] アセチル、3-[(2-、3-、4-又は5-) チアゾリジニル] プロピオニル、2-[(2-、3-、4-又は5-) チアゾリジニル] ベンタノイル、6-[(2-、3-、4-又は5-) チアゾリジニル] ヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-[(2-、3-、4-又は5-) チアゾリジニル] プロピオニル、2-メチル-3-[(2-、3-、4-又は5-) チアゾリジニル] プロピオニル、[2-チオオキソ-4-オキソ-2-(3-又は5-) チアゾリジニル] アセチル、[2-チオオキソ-2-(3-、4-又は5-) チアゾリジニル] アセチル、[2-オキソ-2-(3-、4-又は5-) チアゾリジニル] アセチル、[2, 4-ジチオオキソ-2-(3-又は5-) チアゾリジニル] アセチル基等のチアゾリジン環上に置換基としてオキソ基及びチオオキソ基なる群より選ばれた基を1~2個有することがあり、アルカノイル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるチアゾリジニルアルカノイル基を例示できる。

【0144】

ピペリジニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-[(1-、2-、3-又は4-) ピペリジニル] アセチル、3-[(1-、2-、3-又は4-) ピペリジニル] プロピオニル、2-[(1-、2-、3-又は4-) ピペリジニル] プロピオニル、4-[(1-、2-、3-又は4-) ピペリジニル] ブチリル、5-[(1-、2-、3-又は4-) ピペリジニル] ベンタノイル、6-[(1-、2-、3-又は4-) ピペリジニル] ヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-[(1-、2-、3-又は4-) ピペリジニル] プロピオニル、2-メチル-3-[(1-、2-、3-又は4-) ピペリジニル] プロピオニル基等のアルカノイル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるピペリジニルアルカノイル基を例示できる。

【0145】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルケニルカルボニル基としては、例えば、スチリルカルボニル（慣用名：シンナモイル基）、3-フェニル-2-プロペニルカルボニル基、4-フェニル-2-ブテニルカルボニル基、4-フェニル-3-ブテニルカルボニル基、5-フェニル-4-ベンテニルカルボニル基、5-フェニル-3-ベンテニルカルボニル基、6-フェニル-5-ヘキセニルカルボニル基、6-フェニル-4-ヘキセニルカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセニルカルボニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニルカルボニル基、6-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニルカルボニル、2-クロロスチリルカルボニル、3-(4-プロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、4-(3-フルオロフェニル)-2-ブテニルカルボニル基、4-(2, 4-ジクロロフェニル)-3-ブテニルカルボニル基、5-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-4-ベンテニルカルボニル基、5-(4-ヨードフェニル)-3-ベンテニルカルボニル基、6-(3-クロロフェニル)-5-ヘキセニルカルボニル基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニルカルボニル基、6-(3, 4-ジクロロフェニル)-3-ヘキセニルカルボニル基、4-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-1, 3-ブタジエニルカルボニル基、6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-1, 3, 5-ヘキサトリエニルカルボニル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1~3個有することがあり、アルケニル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状

のアルケニルカルボニル基であり、二重結合を1～3個有するフェニルアルケニルカルボニル基を例示できる。

【0146】

フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル低級アルケニルカルボニル基としては、例えば、3-, 4-メチレンジオキシスチリルカルボニル、3-(2-, 3-エチレンジオキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、4-(3-, 4-トリメチレンジオキシフェニル)-2-ブテニルカルボニル基、4-(2-, 3-テトラメチレンジオキシフェニル)-3-ブテニルカルボニル基、5-(2-, 3-メチレンジオキシフェニル)-4-ペンテニルカルボニル基、5-(3-, 4-エチレンジオキシフェニル)-3-ペンテニルカルボニル基、6-(2-, 3-トリメチレンジオキシフェニル)-5-ヘキセニルカルボニル基、6-(3-, 4-テトラメチレンジオキシフェニル)-4-ヘキセニルカルボニル基、6-(2-, 3-メチレンジオキシフェニル)-3-ヘキセニルカルボニル基、4-(3-, 4-メチレンジオキシフェニル)-1, 3-ブタジエニルカルボニル基、6-(2-, 3-メチレンジオキシフェニル)-1, 3, 5-ヘキサトリエニルカルボニル基等のフェニル環上に置換基として前記記載の炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基を有し、アルケニル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状のアルケニルカルボニル基であり、二重結合を1～3個有するフェニルアルケニルカルボニル基を例示できる。

【0147】

ピリジル低級アルケニルカルボニル基としては、例えば、2-[(2-, 3-又は4-) ピリジル] ビニルカルボニル、3-[(2-, 3-又は4-) ピリジル]-2-プロペニルカルボニル基、4-[(2-, 3-又は4-) ピリジル]-2-ブテニルカルボニル基、4-[(2-, 3-又は4-) ピリジル]-3-ブテニルカルボニル基、5-[(2-, 3-又は4-) ピリジル]-4-ペンテニルカルボニル基、5-[(2-, 3-又は4-) ピリジル]-3-ペンテニルカルボニル基、6-[(2-, 3-又は4-) ピリジル]-5-ヘキセニルカルボニル基、6-[(2-, 3-又は4-) ピリジル]-3-ヘキセニルカルボニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニルカルボニル基、6-[(2-, 3-又は4-) ピリジル]-1, 3, 5-ヘキサトリエニルカルボニル基等のアルケニル部分の炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状のアルケニルカルボニル基であり、二重結合を1～3個有するピリジルアルケニルカルボニル基を例示できる。

【0148】

ピリジルチオ低級アルカノイル基としては、例えば、2-[(2-, 3-又は4-) ピリジルチオ] アセチル、3-[(2-, 3-又は4-) ピリジルチオ] プロピオニル、2-[(2-, 3-又は4-) ピリジルチオ] プロピオニル、4-[(2-, 3-又は4-) ピリジルチオ] ブチリル、5-[(2-, 3-又は4-) ピリジルチオ] ペンタノイル、6-[(2-, 3-又は4-) ピリジルチオ] ヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-[(2-, 3-又は4-) ピリジルチオ] プロピオニル、2-メチル-3-[(2-, 3-又は4-) ピリジルチオ] プロピオニル基等のアルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるピリジルチオアルカノイル基を例示できる。

【0149】

インドリルカルボニル基としては、例えば、1-インドリルカルボニル、2-インドリルカルボニル、3-インドリルカルボニル、4-インドリルカルボニル、5-インドリルカルボニル、6-インドリルカルボニル、7-インドリルカルボニル基を例示できる。

【0150】

ピロリルカルボニル基としては、例えば、2-ピロリルカルボニル、3-ピロリルカルボニル基を例示できる。

【0151】

ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニルカルボニル基としては、例えば、(1-, 2-又は3-) ピロリジニルカルボニル、2-オキソ-(1-

一、3-、4-又は5-) ピロリジニルカルボニル、3-オキソ-(1-、2-、4-又は5-) ピロリジニルカルボニル、2, 5-ジオキソ-(1-又は3-) ピロリジニルカルボニル、2, 3-ジオキシ-(1-、4-又は5-) ピロリジニルカルボニル基等のピロリジン環上に置換基としてオキソ基を1~2個有することのあるピロリジニルカルボニル基を例示できる。

【0152】

ベンゾフリルカルボニル基としては、例えば、2-ベンゾフリルカルボニル、3-ベンゾフリルカルボニル、4-ベンゾフリルカルボニル、5-ベンゾフリルカルボニル、6-ベンゾフリルカルボニル、7-ベンゾフリルカルボニル基等を例示できる。

【0153】

インドリル低級アルカノイル基としては、例えば、2-[(1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-) インドリル] アセチル、3-[(1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-) インドリル] プロピオニル、2-[(1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-) インドリル] プロピオニル、4-[(1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-) インドリル] プチリル、5-[(1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-) インドリル] ペンタノイル、6-[(1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-) インドリル] ヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-[(1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-) インドリル] プロピオニル、2-メチル-3-[(1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-) インドリル] プロピオニル基等のアルカノイル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるインドリルアルカノイル基を例示できる。

【0154】

ベンゾチエニルカルボニル基としては、例えば、2-ベンゾチエニルカルボニル、3-ベンゾチエニルカルボニル、4-ベンゾチエニルカルボニル、5-ベンゾチエニルカルボニル、6-ベンゾチエニルカルボニル、7-ベンゾチエニルカルボニル基等を例示できる。

【0155】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-フェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、2-フェニルプロピオニル、4-フェニルブチリル、5-フェニルペンタノイル、6-フェニルヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-フェニルプロピオニル、2-メチル-3-フェニルプロピオニル、2-(4-フルオロフェニル) アセチル、3-(2, 5-ジフルオロフェニル) プロピオニル、2-(2, 4-ジフルオロフェニル) プロピオニル、4-(3, 4-ジフルオロフェニル) ブチリル、5-(3, 5-ジフルオロフェニル) ペンタノイル、6-(2, 6-ジフルオロフェニル) ヘキサノイル、2-(2-クロロフェニル) アセチル、3-(3-クロロフェニル) プロピオニル、2-(4-クロロフェニル) プロピオニル、4-(2, 3-ジクロロフェニル) プロピオニル、5-(2, 4-ジクロロフェニル) ペンタノイル、6-(2, 5-ジクロロフェニル) ヘキサノイル、2-(3, 4-ジクロロフェニル) アセチル、3-(2, 6-ジクロロフェニル) プロピオニル、2-(3-フルオロフェニル) プロピオニル、4-(2-フルオロフェニル) ブチリル、5-(3-ブロモフェニル) ペンタノイル、6-(4-ヨードフルフェニル) ヘキサノイル、2-(2-ブロモフェニル) アセチル、3-(4-ブロモフルフェニル) プロピオニル、2-(3, 5-ジクロロフェニル) プロピオニル、4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) ブチリル、5-(3, 4-ジフルオロフェニル) ペンタノイル、6-(2-ヨードフェニル) ヘキサノイル、2-(3-ヨードフェニル) アセチル、3-(4-ヨードフェニル) プロピオニル、2-(2, 3-ジブロモフェニル) プロピオニル、4-(2, 4-ジヨードフェニル) ブチリル、2-(2, 4, 6-トリクロロフェニル) アセチル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1~3個有することがあり、アルカノイル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるフェニルアルカノイル基を例示できる。

【0156】

フェニル環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、水酸基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、ハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及びハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニルスルホニル基としては、例えば、フェニルスルホニル、4-メトキシフェニルスルホニル、3-メトキシフェニルスルホニル、2-メトキシフェニルスルホニル、2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル、3-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル、4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル、3, 4-ジメトキシフェニルスルホニル、2, 5-ジメトキシフェニルスルホニル、2, 4, 6-トリメトキシフェニルスルホニル、4-n-ブトキシフェニルスルホニル、2-メトキシ-5-クロロフェニルスルホニル、2-メトキシ-5-メチルフェニルスルホニル、2-メトキシ-4-メチルフェニルスルホニル、4-クロロフェニルスルホニル、3-クロロフェニルスルホニル、2-クロロフェニルスルホニル、4-フルオロフェニルスルホニル、3-フルオロフェニルスルホニル、2-フルオロフェニルスルホニル、4-プロモフェニルスルホニル、3-プロモフェニルスルホニル、2-プロモフェニルスルホニル、2-ジクロロフェニルスルホニル、2, 3-ジクロロフェニルスルホニル、2, 5-ジクロロフェニルスルホニル、2, 4-ジクロロフェニルスルホニル、3, 4-ジクロロフェニルスルホニル、3, 5-ジクロロフェニルスルホニル、2-クロロ-4-フルオロフェニルスルホニル、2-プロモ-5-クロロフェニルスルホニル、2, 5-ジフルオロフェニルスルホニル、2, 4-ジフルオロフェニルスルホニル、2, 6-ジフルオロフェニルスルホニル、3, 4-ジフルオロフェニルスルホニル、2, 4-ジフルオロフェニルスルホニル、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルスルホニル、3-クロロ-4-フルオロフェニルスルホニル、2-クロロ-6-メチルフェニルスルホニル、2, 4-ジメチル-3-クロロフェニルスルホニル、2-メチル-3-クロロフェニルスルホニル、4-メチル-3-クロロフェニルスルホニル、2-メチル-5-フルオロフェニルスルホニル、2-メチル-4-プロモフェニルスルホニル、2-フルオロ-4-プロモフェニルスルホニル、2, 5-ジメチル-4-クロロフェニルスルホニル、2-メチルフェニルスルホニル、3-メチルフェニルスルホニル、4-メチルフェニルスルホニル、2, 5-ジメチルフェニルスルホニル、2, 4, 6-トリメチルフェニルスルホニル、4-tert-ブチルフェニルスルホニル、4-エチルフェニルスルホニル、4-イソプロピルフェニルスルホニル、2-トリフルオロメチルフェニルスルホニル、3-トリフルオロメチルフェニルスルホニル、4-メトキシカルボニルフェニルスルホニル、2-シアノフェニルスルホニル、3-シアノフェニルスルホニル、4-シアノフェニルスルホニル、3-ニトロフェニルスルホニル、2-ニトロフェニルスルホニル、4-ニトロフェニルスルホニル、3-ニトロ-4-メチルフェニルスルホニル、3-ニトロ-6-メチルフェニルスルホニル、3-ニトロ-6-クロロフェニルスルホニル、2-クロロ-4-シアノフェニルスルホニル、4-アセチルアミノフェニルスルホニル、3-クロロ-4-アセチルアミノフェニルスルホニル、2-ヒドロキシ-3, 5-ジクロロフェニルスルホニル、2-ヒドロキシフェニルスルホニル、3-ヒドロキシフェニルスルホニル、4-ヒドロキシフェニルスルホニル、2-ニトロ-4-メトキシフェニルスルホニル、3-カルボキシフェニルスルホニル、4-(2-メトキシカルボニルエチル)フェニルスルホニル、3-カルボキシ-4-ヒドロキシフェニルスルホニル、3-アミノフェニルスルホニル、2-アミノフェニルスルホニル、4-アミノフェニルスルホニル基等のフェニル環上に置換基として、前記例示のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を1～2個有することのあるアミノ基、水酸基、カルボキシ基、前記例示のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であり、アルキル部分が

炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるアルコキシカルボニルアルキル基、ハロゲン原子、前記例示のハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び前記例示のハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基なる群から選ばれた基を1～5個有することのあるフェニルスルホニル基を例示できる。

【0157】

チオフェン環上に置換基としてハロゲン原子及び低級アルコキシカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるチエニルスルホニル基としては、例えば、(2-又は3-)チエニルスルホニル、[2-クロロー(3-、4-又は5-)チエニル]スルホニル、[2,3-ジクロロー(4-又は5-)チエニル]スルホニル、[2,5-ジクロロー(3-又は4-)チエニル]スルホニル、[2-プロモ(3-、4-又は5-)チエニル]スルホニル、(2,3,4-トリクロロー5-チエニル)スルホニル、[2-メトキシカルボニル-(3-、4-又は5-)チエニル]スルホニル、[3-エトキシカルボニル-(2-、4-又は5-)チエニル]スルホニル、[3-n-プロポキシカルボニル-(2-、4-又は5-)チエニル]スルホニル、[2-tert-ブトキシカルボニル-(3-、4-又は5-)チエニル]スルホニル、[2-n-ペンチルオキシカルボニル-(3-、4-又は5-)チエニル]スルホニル、[3-n-ヘキシルオキシカルボニル-(2-、4-又は5-)チエニル]スルホニル、[2,3-ジメトキシカルボニル-(4-又は5-)チエニル]スルホニル、[2-クロロー3-メトキシカルボニル-(4-又は5-)チエニル]スルホニル基等のチオフェン環上に置換基としてハロゲン原子及び前記例示のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアルコキシカルボニル基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるチエニルスルホニル基を例示できる。

【0158】

キノリルスルホニル基としては、例えば、2-キノリルスルホニル、3-キノリルスルホニル、4-キノリルスルホニル、5-キノリルスルホニル、6-キノリルスルホニル、7-キノリルスルホニル、8-キノリルスルホニル基等を例示できる。

【0159】

イミダゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイミダゾリルスルホニル基としては、例えば、(1-、2-、4-又は5-)イミダゾリルスルホニル、[1-メチル-(2-、4-又は5-)イミダゾリル]スルホニル、[2-エチル-(1-、4-又は5-)イミダゾリル]スルホニル、[1-イソプロピル-(2-、4-又は5-)イミダゾリル]スルホニル、[4-n-ブチル-(1-、2-又は5-)イミダゾリル]スルホニル、[5-n-ペンチル-(1-、2-又は4-)イミダゾリル]スルホニル、[1-n-ヘキシル-(2-、4-又は5-)イミダゾリル]スルホニル、[1,2-ジメチル-(4-又は5-)イミダゾリル]スルホニル、(1,2,4-トリメチル5-イミダゾリル)スルホニル基等のイミダゾール環上に置換基として前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのあるイミダゾリルスルホニル基を例示できる。

【0160】

フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有するフェニルスルホニル基としては、例えば、(3,4-エチレンジオキシフェニル)スルホニル、(2,3-メチレンジオキシフェニル)スルホニル、(3,4-トリメチレンジオキシフェニル)スルホニル、(2,3-テトラメチレンジオキシフェニル)スルホニル基等のフェニル環上に置換基として前記例示の炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基を有するフェニルスルホニル基を例示できる。

【0161】

低級アルケニルスルホニル基としては、例えば、例えればビニルスルホニル、1-プロペニルスルホニル、1-メチル-1-プロペニルスルホニル、2-メチル-1-プロペニルスルホニル、2-プロペニルスルホニル、2-ブテニルスルホニル、1-ブテニルスルホ

ニル、3-ブテニルスルホニル、2-ベンテニルスルホニル、1-ベンテニルスルホニル、3-ベンテニルスルホニル、4-ベンテニルスルホニル、1, 3-ブタジエニルスルホニル、1, 3-ベンタジエニルスルホニル、2-ベンテン-4-イニルスルホニル、2-ヘキセニルスルホニル、1-ヘキセニルスルホニル、5-ヘキセニルスルホニル、3-ヘキセニルスルホニル、4-ヘキセニルスルホニル、3, 3-ジメチル-1-プロペニルスルホニル、2-エチル-1-プロペニルスルホニル、1, 3, 5-ヘキサトリエニルスルホニル、1, 3-ヘキサジエニルスルホニル、1, 4-ヘキサジエニルスルホニル基等の二重結合を1～3個有する炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニルスルホニル基を例示できる。

【0162】

シクロアルキル低級アルキルスルホニル基としては、例えば、シクロプロピルメチルスルホニル、シクロヘキシリメチルスルホニル、2-シクロプロピルエチルスルホニル、1-シクロブチルエチルスルホニル、シクロペンチルメチルスルホニル、3-シクロペンチルプロピルスルホニル、4-シクロヘキシリブチルスルホニル、5-シクロヘプチルペンチルスルホニル、6-シクロオクチルヘキシリスルホニル、1, 1-ジメチル-2-シクロヘキシリエチルスルホニル、2-メチル-3-シクロプロピルプロピルスルホニル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である炭素数3～8のシクロアルキルアルキルスルホニル基を挙げることができる。

【0163】

3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのある3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニルスルホニル基としては、例えば、(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニルスルホニル、[4-メチル-(2-、3-、5-、6-、7-又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニル]スルホニル、[5-エチル-(2-、3-、4-、6-、7-又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニル]スルホニル、[6-n-プロピル-(2-、3-、4-、5-、7-又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニル]スルホニル、[7-n-ブチル-(2-、3-、5-、6-、7-又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニル]スルホニル、[8-n-ペンチル-(2-、3-、5-、6-、7-又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニル]スルホニル、[2-n-ヘキシリ-(3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニル]スルホニル、[3-メチル-(2-、4-、5-、6-、7-又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニル]スルホニル、[4, 6-ジメチル-(2-、3-、5-、7-又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニル]スルホニル、[4, 5, 6-トリメチル-(2-、3-、7-又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニル]スルホニル基等の3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジン環上に置換基として前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～3個有することのある3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾキサジニルスルホニル基を例示できる。

【0164】

ピラゾール環上に置換基としてハロゲン原子及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるピラゾリルスルホニル基としては、例えば、(1-、3-、4-又は5-)ピラゾリルスルホニル、(1, 3-ジメチル-5-クロロ-4-ピラゾリル)スルホニル、[1-エチル-(3-、4-又は5-)ピラゾリル]スルホニル、[3-n-ブロピル-(1-、4-又は5-)ピラゾリル]スルホニル、[4-n-ブチル-(3-、4-又は5-)ピラゾリル]スルホニル、[5-n-ペンチル-(1-、3-又は4-)ピラゾリル]スルホニル、[1-n-ヘキシリ-(3-、4-又は5-)ピラゾリル]スルホニル、[1, 3-ジメチル-(4-又は5-)ピラゾリル]スルホニル、(1, 3, 5-トリメチル-4-ピラゾリル)スルホニル、[3-プロモ-(1-、4-又は5-)ピラゾリル]スルホニル、[4-フルオロー-(1-、3-又は5-)ピラゾリル]スルホニル、

ニル、 [5-ヨード- (1-、 3-又は4-) ピラゾリル] スルホニル、 [3, 4-ジクロロ- (1-又は5-) ピラゾリル] スルホニル、 (3, 4, 5-トリクロロ-4-ピラゾリル) スルホニル基等のピラゾール環上に置換基としてハロゲン原子及び前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるピラゾリルスルホニル基を例示できる。

【0165】

イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリルスルホニル基としては、例えば、 (3-、 4-又は5-) イソオキサゾリルスルホニル、 (3, 5-ジメチル-4-イソオキサゾリル) スルホニル、 [3-メチル- (4-又は5-) イソオキサゾリル] スルホニル、 [3-エチル- (4-又は5-) イソオキサゾリル] スルホニル、 [4-n-プロピル- (3-又は5-) イソオキサゾリル] スルホニル、 [5-n-ブチル- (3-又は4-) イソオキサゾリル] スルホニル、 [3-n-ペンチル- (4-又は5-) イソオキサゾリル] スルホニル、 [4-n-ヘキシル- (3-又は5-) イソオキサゾリル] スルホニル基等のイソオキサゾール環上に置換基として前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるイソオキサゾリルスルホニル基を例示できる。

【0166】

チアゾール環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基及び低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるチアゾリルスルホニル基としては、例えば、 (2-、 4-又は5-) チアゾリルスルホニル、 (2-アセチルアミノ-4-メチル-5-チアゾリル) スルホニル、 [2-エチル- (4-又は5-) チアゾリル] スルホニル、 [4-n-プロピル- (2-又は5-) チアゾリル] スルホニル、 [5-n-ブチル- (2-又は4-) チアゾリル] スルホニル、 [2-n-ペンチル- (4-又は5-) チアゾリル] スルホニル、 [4-n-ヘキシル- (2-又は5-) チアゾリル] スルホニル、 (2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) スルホニル、 [2-アミノ- (4-又は5-) チアゾリル] スルホニル、 [2-ホルミルアミノ- (4-又は5-) チアゾリル] スルホニル、 [4-n-プロピオニルアミノ- (2-又は5-) チアゾリル] スルホニル、 [5-n-ブチリルアミノ- (2-又は4-) チアゾリル] スルホニル、 [2-n-ペンタノイルアミノ- (4-又は5-) チアゾリル] スルホニル、 [4-n-ヘキサノイルアミノ- (2-又は5-) チアゾリル] スルホニル、 (2, 4-ジアセチル-5-チアゾリル) スルホニル、 [2-(N, N-ジアセチルアミノ)- (4-又は5-) チアゾリル] スルホニル基等のチアゾール環上に置換基として前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を1～2個有することのあるアミノ基及び前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を1～2個有することのあるチアゾリルスルホニル基を例示できる。

【0167】

フェニル低級アルキルスルホニル基としては、例えば、ベンジルスルホニル、1-フェニルスルホニル、2-フェニルスルホニル、3-フェニルプロピルスルホニル、2-フェニルプロピルスルホニル、4-フェニルブチルスルホニル、5-フェニルペンチルスルホニル、4-フェニルペンチルスルホニル、6-フェニルヘキシルスルホニル、2-メチル-3-フェニルプロピルスルホニル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチルスルホニル、1, 1-ジメチル-1-フェニルメチルスルホニル、1, 1-ジフェニルメチルスルホニル、2, 2-ジフェニルエチルスルホニル、3, 3-ジフェニルプロピルスルホニル、1, 2-ジフェニルエチルスルホニル基等のフェニル基を1～2個有し、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

【0168】

フェニル低級アルケニルスルホニル基としては、例えば、スチリルスルホニル、3-フェニル-2-プロペニルスルホニル基、4-フェニル-2-ブテニルスルホニル基、4-フェニル-3-ブテニルスルホニル基、5-フェニル-4-ペンテニルスルホニル基、5

—フェニル—3—ペンテニルスルホニル基、6—フェニル—5—ヘキセニルスルホニル基、6—フェニル—4—ヘキセニルスルホニル基、6—フェニル—3—ヘキセニルスルホニル基、4—フェニル—1, 3—ブタジエニルスルホニル基、6—フェニル—1, 3, 5—ヘキサトリエニルスルホニル、2—クロロスチリルスルホニル、3—(4—プロモフェニル)—2—プロペニルスルホニル基、4—(3—フルオロフェニル)—2—ブテニルスルホニル基、4—(2, 4—ジクロロフェニル)—3—ブテニルスルホニル基、5—(2, 4, 6—トリフルオロフェニル)—4—ペンテニルスルホニル基、5—(4—ヨードフェニル)—3—ペンテニルスルホニル基、6—(3—クロロフェニル)—5—ヘキセニルスルホニル基、6—(4—クロロフェニル)—4—ヘキセニルスルホニル基、6—(3, 4—ジクロロフェニル)—3—ヘキセニルスルホニル基、4—(3—クロロ—4—フルオロフェニル)—1, 3—ブタジエニルスルホニル基、6—(2, 6—ジフルオロフェニル)—1, 3, 5—ヘキサトリエニルスルホニル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することがあり、アルケニル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状のアルケニルスルホニル基であり、二重結合を1～3個有するフェニルアルケニルスルホニル基を例示できる。

【0169】

ナフチルオキシカルボニル基としては、例えば、1—ナフチルオキシカルボニル、2—ナフチルオキシカルボニル基等を例示できる。

【0170】

低級アルキニルオキシカルボニル基としては、例えば、エチニルオキシカルボニル、2—プロピニルオキシカルボニル、2—ブチニルオキシカルボニル、3—ブチニルオキシカルボニル、1—メチル—2—プロピニルオキシカルボニル、2—ペンチニルオキシカルボニル、2—ヘキシニルオキシカルボニル基等のアルキニル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルキニル基であるアルキニルオキシカルボニル基を例示できる。

【0171】

低級アルケニルオキシカルボニル基としては、例えば、ビニルオキシカルボニル、1—プロペニルオキシカルボニル、1—メチル—1—プロペニルオキシカルボニル、2—メチル—1—プロペニルオキシカルボニル、2—プロペニルオキシカルボニル、2—ブテニルオキシカルボニル、1—ブテニルオキシカルボニル、3—ブテニルオキシカルボニル、2—ペンテニルオキシカルボニル、1—ペンテニルオキシカルボニル、3—ペンテニルオキシカルボニル、4—ペンテニルオキシカルボニル、1, 3—ブタジエニルオキシカルボニル、1, 3—ペンタジエニルオキシカルボニル、2—ペンテン—4—イニルオキシカルボニル、2—ヘキセニルオキシカルボニル、1—ヘキセニルオキシカルボニル、5—ヘキセニルオキシカルボニル、3—ヘキセニルオキシカルボニル、4—ヘキセニルオキシカルボニル、3, 3—ジメチル—1—プロペニルオキシカルボニル、2—エチル—1—プロペニルオキシカルボニル、1, 3, 5—ヘキサトリエニルオキシカルボニル、1, 3—ヘキサジエニルオキシカルボニル基等の二重結合を1～3個有し、アルケニル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基であるアルケニルオキシカルボニル基を例示できる。

【0172】

フェニル低級アルコキシ置換低級アルコキシカルボニル基としては、例えば、フェニルメトキシメトキシカルボニル、2—(フェニルメトキシ)エトキシカルボニル、1—(フェニルメトキシ)エトキシカルボニル、3—(フェニルメトキシ)プロポキシカルボニル、4—(フェニルメトキシ)ブトキシカルボニル、5—(フェニルメトキシ)ペンチルオキシカルボニル、6—(フェニルメトキシ)ヘキシルオキシカルボニル、1, 1—ジメチル—2—(フェニルメトキシ)エトキシカルボニル、2—メチル—3—(フェニルメトキシ)プロポキシカルボニル、1—(2—フェニルエトキシ)エトキシカルボニル、2—(1—フェニルエトキシ)エトキシカルボニル、3—(3—フェニルプロポキシ)プロポキシカルボニル、4—(4—フェニルブトキシ)ブトキシカルボニル、5—(5—フェニルペンチルオキシ)ペンチルオキシカルボニル、6—(6—フェニルヘキシルオキ

シ) ヘキシリオキシカルボニル、(1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシ) メトキシカルボニル、3-(2-メチル-3-フェニルプロポポキシ) プロポキシカルボニル基等の2つのアルコキシ部分が共に炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ置換アルコキシカルボニル基を例示できる。

【0173】

シクロアルキル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるシクロアルキルオキシカルボニル基としては、例えば、例えはシクロプロピルオキシカルボニル、シクロブチルオキシカルボニル、シクロペンチルオキシカルボニル、シクロヘキシリオキシカルボニル、シクロヘプチルオキシカルボニル、シクロオクチルオキシカルボニル、3-メチル-6-イソプロピルシクロヘキシリオキシカルボニル、2-エチルシクロプロピルオキシカルボニル、2-n-プロピルシクロブチルオキシカルボニル、3-n-ブチルシクロヘプチルオキシカルボニル、3-n-ペンチルシクロオクチルオキシカルボニル、2-メチルソシシクロペンチルオキシカルボニル、2, 3, 6-トリメチルシクロヘキシリオキシカルボニル基等のシクロアルキル環上に置換基として前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することがあり、シクロアルキル部分が炭素数3~8のシクロアルキル基であるシクロアルキルオキシカルボニル基を挙げることができる。

【0174】

イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリル基としては、例えば、(3-、4-又は5-) イソオキサゾリル、5-メチル-(3-又は4-) イソオキサゾリル、3, 5-ジメチル-4-イソオキサゾリル、3-エチル-(4-又は5-) イソオキサゾリル、4-n-プロピル-(3-又は5-) イソオキサゾリル、5-n-ブチル-(3-又は4-) イソオキサゾリル、3-n-ペンチル-(4-又は5-) イソオキサゾリル、4-n-ヘキシル-(3-又は5-) イソオキサゾリル基等のイソオキサゾール環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるイソオキサゾリル基を例示できる。

【0175】

R⁶及びR⁷が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して形成される5~7員の飽和複素環としては、例えは、ピロリジン、ピペラジン、ピペリジン、モルホリン、チオモルホリン、ホモピペラジン、ホモピペリニジン、イミダゾリジン、チアゾリジン、イソチアゾリジン、オキサゾリジン、イソオキサゾリジン、イソチアゾリジン、ピラゾリジン等の、隣接する窒素原子と共に酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を介しもしくは介することなく互いに結合して形成される5~7員の飽和複素環を例示できる。

【0176】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、シアノ基及び水酸基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル基としては、例えは、フェニル、4-イソプロピルフェニル、3-イソプロピルフェニル、2-イソプロピルフェニル、4-t e r t -ブチルフェニル、4-メチルフェニル、3-メチルフェニル、2-メチルフェニル、2, 3-ジメチルフェニル、2, 4-ジメチルフェニル、3, 5-ジメチルフェニル、2, 4, 6-トリメチルフェニル、4-メチル-3-メトキシフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、4-メチル-3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、3-クロロフェニル、2-クロロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、3-プロモフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、3, 4, 5-トリクロロフェニル、2, 4, 6-トリフルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、2-クロロ-5-フルオロフェニル、3-フルオロ-4-メトキシフェニル、3-クロロ-4-メトキシフェニル、3-クロロ-4-ヒドロキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-メトキシフェニル、2-メトキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、2, 4, 6-トリメトキ

シフェニル、2-メトキシ-5-クロロフェニル、4-エトキシフェニル、4-トリフルオロメトキシフェニル、3-トリフルオロメトキシフェニル、2-トリフルオロメトキシフェニル、3-メトキシ-5-トリフルオロメチルフェニル、2-シアノフェニル、3-シアノフェニル、4-シアノフェニル、3-ヒドロキシフェニル、2-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子、前記例示のハロゲン原子1～3個を有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、前記例示のハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、シアノ基及び水酸基なる群から選ばれた基を1～3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0177】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、例えば、ベンジル、1-フェネチル、2-フェネチル、3-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、1, 1-ジフェニルメチル、2, 2-ジフェニルエチル、3, 3-ジフェニルプロピル、1, 2-ジフェニルエチル、4-クロロベンジル、2-クロロベンジル、3-クロロベンジル、2-フルオロベンジル、3-フルオロベンジル、4-フルオロベンジル、2, 3-ジクロロベンジル、2, 4, 6-トリフルオロベンジル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することのあるフェニル基を1～2個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0178】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルコキシ基としては、例えば、ベンジルオキシ、2-フェニルエトキシ、1-フェニルエトキシ、3-フェニルプロポキシ、4-フェニルブトキシ、5-フェニルペンチルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシ、2-メチル-3-フェニルプロポキシ、4-クロロベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-クロロベンジルオキシ、2-フルオロベンジルオキシ、3-フルオロベンジルオキシ、4-フルオロベンジルオキシ、2, 4-ジプロモベンジルオキシ、2, 4, 6-トリフルオロベンジルオキシ基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基を例示できる。

【0179】

低級アルキル基及びフェニル基なる群から選ばれた基を有することのあるカルバモイル低級アルキル基としては、例えば、カルバモイルメチル、2-カルバモイルエチル、1-カルバモイルエチル、3-カルバモイルプロピル、4-カルバモイルブチル、5-カルバモイルペンチル、6-カルバモイルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-カルバモイルエチル、2-メチル-3-カルバモイルプロピル、2-(N-メチル-N-フェニルカルバモイル)エチル、N-フェニルカルバモイルメチル、2-(N, N-ジメチルカルバモイル)エチル、3-(N-フェニルカルバモイル)プロピル、2-(N-エチル-N-フェニルカルバモイル)エチル、N, N-ジメチルカルバモイルメチル、N-メチル-N-エチルカルバモイルメチル、N-メチルカルバモイルメチル、2-(N-メチルカルバモイル)エチル基等の前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びフェニル基なる群から選ばれた基を1～2個有することがあり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるカルバモイルアルキル基を例示できる。

【0180】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルキリデン基としては、例えば、フェニルメチリデン、フェニルエチリデン、フェニルプロピリデン、フェニルイソプロピリデン、フェニルブチリデン、フェニルペンチリデン、フェニルヘキシリデン、2-クロロフェニルメチリデン、3-クロロフェニルメチリデン、4-クロロフェニルメチリデン、2-フルオロフェニルメチリデン、3-フルオロフェニルメチ

リデン、4-フルオロフェニルメチリデン、2-ブロモフェニルメチリデン、3-ブロモフェニルメチリデン、4-ブロモフェニルメチリデン、2-ヨードフェニルメチリデン、2, 3-ジクロロフェニルメチリデン、2, 4-ジフルオロフェニルメチリデン、2, 4, 6-トリクロロフェニルメチリデン、2, 3, 5-トリフルオロフェニルメチリデン、2-フルオロー-4-クロロフェニルメチリデン基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することがあり、アルキリデン部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキリデン基であるフェニルアルキリデン基を例示できる。

【0181】

フェニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル、2-フェニルエトキシカルボニル、1-フェニルエトキシカルボニル、3-フェニルプロポキシカルボニル、4-フェニルブトキシカルボニル、5-フェニルペンチルオキシカルボニル、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシカルボニル、2-メチル-3-フェニルプロポキシカルボニル基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシカルボニル基を例示できる。

【0182】

ピリジン環上に置換基としてシアノ基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピリジル基としては、例えば、(2-、3-又は4-)ピリジル、2-メチル-(3-、4-、5-又は6-)ピリジル、3-メチル-(2-、4-、5-又は6-)ピリジル、4-メチル-(2-又は3-)ピリジル、2-シアノ-(3-、4-、5-又は6-)ピリジル、3-シアノ-(2-、4-、5-又は6-)ピリジル、2, 3-ジメチル-(4-、5-又は6-)ピリジル、3, 4, 5-トリメチル-(2-又は6-)ピリジル、2, 4, 5-トリシアノ-(3-又は6-)ピリジル、2-メチル-4-シアノ-(3-、5-又は6-)ピリジル基等のピリジン環上に置換基としてシアノ基及び前記例示の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群から選ばれた基を1～3個有することのあるピリジル基を例示できる。

【0183】

1, 3-ジオキソラニル低級アルキル基としては、例えば、[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]メチル、2-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]エチル、1-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]エチル、3-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]プロピル、4-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]ブチル、1, 1-ジメチル-2-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]エチル、5-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]ペンチル、6-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]ヘキシル、1-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]イソブロピル、2-メチル-3-[(1-、2-又は4-)イミダゾリル]プロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である1, 3-ジオキソラニルアルキル基を例示できる。

【0184】

R^8 及び R^9 、 R^{11} 及び R^{12} 又は R^{13} 及び R^{14} が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して形成される5又は6員の飽和複素環としては、例えば、ピロリジン、ピペラジン、ピペリジン、モルホリン、チオモルホリン、イミダゾリジン、チアゾリジン、イソチアゾリジン、オキサゾリジン、イソオキサゾリジン、イソチアゾリジン、ピラゾリジン等の隣接する窒素原子と共に酸素原子、窒素原子又は硫黄原子を介しもしくは介することなく互いに結合して形成される5又は6員の飽和複素環を例示できる。

【0185】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、フェニル基、ハロゲン原子、シアノ基、フェノキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ピラゾリル基及びハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有す

ことのあるベンゾイル基としては、例えば、ベンゾイル、4-メチルベンゾイル、3-メチルベンゾイル、2-メチルベンゾイル、4-tert-ブチルベンゾイル、2, 4-ジメチルベンゾイル、2, 4, 6-トリメチルベンゾイル、3-トリフルオロメチルベンゾイル、4-トリフルオロメチルベンゾイル、2-トリフルオロメチルベンゾイル、4-フェニルベンゾイル、4-クロロベンゾイル、3-クロロベンゾイル、2-クロロベンゾイル、4-フルオロベンゾイル、3-フルオロベンゾイル、2-フルオロベンゾイル、3-ブロモベンゾイル、2-ブロモベンゾイル、4-ブロモベンゾイル、3, 4-ジクロロベンゾイル、2, 3-ジクロロベンゾイル、2-クロロ-4-フルオロベンゾイル、2-メトキシ-5-クロロベンゾイル、4-メトキシベンゾイル、3-メトキシベンゾイル、2-メトキシベンゾイル、3, 4-ジメトキシベンゾイル、3, 4, 5-トリメトキシベンゾイル、3-トリフルオロメトキシベンゾイル、4-トリフルオロメトキシベンゾイル、2-トリフルオロメトキシベンゾイル、3-シアノベンゾイル、4-シアノベンゾイル、2-シアノベンゾイル、3-フェノキシベンゾイル、2-フェノキシベンゾイル、4-フェノキシベンゾイル、4-メトキシカルボニルベンゾイル、3-エトキシカルボニルベンゾイル、2-tert-ブトキシカルボニルベンゾイル、4-(1-ピラゾリル)ベンゾイル基等のフェニル環上に置換基として前記例示のハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、フェニル基、ハロゲン原子、シアノ基、フェノキシ基、前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基、ピラゾリル基及び前記例示のハロゲン原子1~3個を有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるベンゾイル基を例示できる。

【0186】

アルカノイル基としては、前記低級アルカノイル基に加えて、ヘプタノイル、オクタノイル、ノナノイル、デカノイル、2-エチル-ヘキサノイル基等の炭素数1~10の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を例示できる。

【0187】

フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-フェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、2-フェニルプロピオニル、4-フェニルブチリル、5-フェニルペンタノイル、6-フェニルヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-フェニルプロピオニル、2-メチル-3-フェニルプロピオニル、2-(4-フルオロフェニル)アセチル、3-(2, 5-ジフルオロフェニル)プロピオニル、2-(2, 4-ジフルオロフェニル)プロピオニル、4-(3, 4-ジフルオロフェニル)ブチリル、5-(3, 5-ジフルオロフェニル)ペンタノイル、6-(2, 6-ジフルオロフェニル)ヘキサノイル、2-(2-クロロフェニル)アセチル、3-(3-クロロフェニル)プロピオニル、2-(4-クロロフェニル)プロピオニル、4-(2, 3-ジクロロフェニル)プロピオニル、5-(2, 4-ジクロロフェニル)ペンタノイル、6-(2, 5-ジクロロフェニル)ヘキサノイル、2-(3, 4-ジクロロフェニル)アセチル、3-(2, 6-ジクロロフェニル)プロピオニル、2-(3-フルオロフェニル)プロピオニル、4-(2-フルオロフェニル)ブチリル、5-(3-ブロモフェニル)ペンタノイル、6-(4-ヨードフェニル)ヘキサノイル、2-(2-ブロモフェニル)アセチル、3-(4-ブロモフェニル)プロピオニル、2-(3, 5-ジクロロフェニル)プロピオニル、4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ブチリル、5-(3, 4-ジフルオロフェニル)ペンタノイル、6-(2-ヨードフェニル)ヘキサノイル、2-(3-ヨードフェニル)アセチル、3-(4-ヨードフェニル)プロピオニル、2-(2, 3-ジブロモフェニル)プロピオニル、4-(2, 4-ジヨードフェニル)ブチリル、2-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)アセチル、2-(4-メチルフェニル)アセチル、3-(2, 5-ジメチルフェニル)プロピオニル、2-(2, 4-ジエチルフェニル)プロピオニル、4-(3, 4-ジ-n-プロピルフェニル)ブチリル、2-(2-エチルフェニル)アセチル、3-(3-n-プロピルフェニル)プロピオニル、2-(4-tert-ブチルフェニル)プロピ

オニル、2-(2,4,6-トリメチルフェニル)アセチル、2-(2,5-ジクロロ-4-メチルフェニル)アセチル、2-(3-メチル-4-クロロフェニル)アセチル、4-(2-n-ブチルフェニル)ブチリル、5-(3-n-ペンチルフェニル)ペンタノイル、6-(4-n-ヘキシルフェニル)ヘキサノイル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基を1~3個有することがあり、アルカノイル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるフェニルアルカノイル基を例示できる。

[0 1 8 8]

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシ低級アルカノイル基としては、前記フェノキシ低級アルカノイル基に加えて、2-(4-クロロフェノキシ)アセチル、2-(4-フルオロフェノキシ)アセチル、3-(2,5-ジフルオロフェノキシ)プロピオニル、2-(2,4-ジフルオロフェノキシ)プロピオニル、4-(3,4-ジフルオロフェノキシ)ブチリル、5-(3,5-ジフルオロフェノキシ)ペントノイル、6-(2,6-ジフルオロフェノキシ)ヘキサノイル、2-(2-クロロフェノキシ)アセチル、3-(3-クロロフェノキシ)プロピオニル、2-(4-クロロフェノキシ)プロピオニル、4-(2,3-ジクロロフェノキシ)プロピオニル、5-(2,4-ジクロロフェノキシ)ペントノイル、6-(2,5-ジクロロフェノキシ)ヘキサノイル、2-(3,4-ジクロロフェノキシ)アセチル、3-(2,6-ジクロロフェノキシ)プロピオニル、4-(2-フルオロフェノキシ)ブチリル、5-(3-ブロモフェノキシ)ペントノイル、6-(4-ヨードフェノキシ)ヘキサノイル、2-(2-ブロモフェノキシ)アセチル、3-(4-ブロモフェノキシ)プロピオニル、2-(3,5-ジクロロフェノキシ)プロピオニル、4-(2,4,6-トリフルオロフェノキシ)ブチリル、5-(3,4-ジフルオロフェノキシ)ペントノイル、6-(2-ヨードフェノキシ)ヘキサノイル、2-(3-ヨードフェノキシ)アセチル、3-(4-ヨードフェノキシ)プロピオニル、2-(2,3-ジブロモフェノキシ)プロピオニル、4-(2,4-ジヨードフェノキシ)ブチリル、2-(2,4,6-トリクロロフェノキシ)アセチル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1~3個有することがあり、アルカノイル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるフェノキシアルカノイル基を例示できる。

[0189]

フェニル低級アルケニルカルボニル基としては、例えば、スチリルカルボニル（慣用名：シンナモイル基）、3-フェニル-2-プロペニルカルボニル基、4-フェニル-2-ブテニルカルボニル基、4-フェニル-3-ブテニルカルボニル基、5-フェニル-4-ペンテニルカルボニル基、5-フェニル-3-ペンテニルカルボニル基、6-フェニル-5-ヘキセニルカルボニル基、6-フェニル-4-ヘキセニルカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセニルカルボニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニルカルボニル基、6-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニルカルボニル基等のアルケニル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状のアルケニルカルボニル基であり、二重結合を1~3個有するフェニルアルケニルカルボニル基を例示できる。

[0190]

ピリジン環上に置換基としてハロゲン原子及びハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピリジルカルボニル基としては、例えば、(2-、3-又は4-)ピリジルカルボニル、2-クロロー-(3-、4-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、2, 6-ジクロロー-(3-、4-又は5-)ピリジルカルボニル、2, 3-ジクロロー-(4-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、2-トリフルオロメチル-(3-、4-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、2-プロモ-(3-、4-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、2, 6-ジフルオロー-(3-、4-又は5-)ピリジルカルボニル、4-メチル-(2-、3-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、3-クロロー-(2-、4-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、2, 5-ジプロモ-(3-、4-又は5-)ピリジルカルボニル、2-エチル-4-クロロー-(3-、5-又は

6-) ピリジルカルボニル、2, 4, 6-トリフルオロー(3-又は5-)ピリジルカルボニル、2, 4-ジメチル-(3-、5-又は6-)ピリジルカルボニル、2, 4, 6-トリメチル-(3-又は5-)ピリジルカルボニル、2-メチル-4-クロロー-(3-、5-又は6-)ピリジルカルボニル基等のピリジン環上に置換基としてハロゲン原子及び前記例示のハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるピリジルカルボニル基を例示できる。

[0191]

ピペリジン環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるピペリジニルカルボニル基としては、例えば、(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1-アセチル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1-n-プロパノイル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1-イソプロパノイル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1-n-ブチリル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1-n-ペンタノイル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1-n-ヘキサノイル-(2-、3-又は4-)ピペリジニルカルボニル、1, 2-ジアセチル-(3-、4-、5-又は6-)ピペリジニルカルボニル、1, 2, 3-トリアセチル-(4-、5-又は6-)ピペリジニルカルボニル、2-アセチル-(1-、3-、4-、5-又は6-)ピペリジニルカルボニル、3-プロパノイル-(1-、2-、4-、5-又は6-)ピペリジニルカルボニル、2-ホルミル-4-プロパノイル-(1-、3-、5-又は6-)ピペリジニルカルボニル基等のピペリジン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルカノイル基を1~3個有することのあるピペリジニルカルボニル基を例示できる。

[0192]

テトラヒドロピラニルカルボニル基としては、例えば、2-テトラヒドロピラニルカルボニル、3-テトラヒドロピラニルカルボニル、4-テトラヒドロピラニルカルボニル基等を例示できる。

[0193]

ベンゾチオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾチエニルカルボニル基としては、例えば、(2-、3-、4-、5-、6-又は7-)ベンゾチエニルカルボニル、[3-クロロー(2-、4-、5-、6-又は7-)ベンゾチエニル]カルボニル、[4-ブロモ(2-、3-、5-、6-又は7-)ベンゾチエニル]カルボニル、[5-フルオロー(2-、3-、4-、6-又は7-)ベンゾチエニル]カルボニル、[6-ヨード(2-、3-、4-、5-又は7-)ベンゾチエニル]カルボニル、[7-クロロー(2-、3-、4-、5-又は6-)ベンゾチエニル]カルボニル、[2-クロロー(3-、4-、5-、6-又は7-)ベンゾチエニル]カルボニル、[2,3-ジクロロー(4-、5-、6-又は7-)ベンゾチエニル]カルボニル、[3,4,6-トリクロロー(2-、5-又は7-)ベンゾチエニル]カルボニル基等のベンゾチオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのあるベンゾチエニルカルボニル基を例示できる。

【0194】

ピリジン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基を有することのあるピリジル低級アルキル基としては、例えば、(2-、3-又は4-)ピリジルメチル、2-[(2-、3-又は4-)ピリジル]エチル、1-[(2-、3-又は4-)ピリジル]エチル、3-[(2-、3-又は4-)ピリジル]プロピル、4-[(2-、3-又は4-)ピリジル]ブチル、1, 1-ジメチル-2-[(2-、3-又は4-)ピリジル]エチル、5-[(2-、3-又は4-)ピリジル]ペンチル、6-[(2-、3-又は4-)ピリジル]ヘキシル、1-[(2-、3-又は4-)ピリジル]イソプロピル、2-メチル-3-[(2-、3-又は4-)ピリジル]プロピル、[2-クロロー-(3-、4-、5-又は6-)ピリジル]メチル、[2, 3-ジクロロー-(4-、5-又は6-)ピリジル]メチル、[2-ブロモ-(3-

一、4一、5一又は6一) ピリジル] メチル、[2, 4, 6-トリフルオロー(3一、5一又は6一) ピリジル] メチル、[2-トリフルオロメチル-(3一、4一、5一又は6一) ピリジル] メチル、[2-メチル-(3一、4一、5一又は6一) ピリジル] メチル、[2-エチル-(3一、4一、5一又は6一) ピリジル] メチル、2-[2-n-プロピル-(3一、4一、5一又は6一) ピリジル] エチル、3-[2-n-ブチル-(3一、4一、5一又は6一) ピリジル] プロピル、4-[2-n-ペンチル-(3一、4一、5一又は6一) ピリジル] ブチル、5-[2-n-ヘキシル-(3一、4一、5一又は6一) ピリジル] ペンチル、6-[2-イソプロピル-(3一、4一、5一又は6一) ピリジル] ヘキシル、[2-tert-ブチル-(3一、4一、5一又は6一) ピリジル] メチル、[2, 4-ジメチル-(3一、5一又は6一) ピリジル] メチル、[2, 4, 6-トリメチル-(3一又は5一) ピリジル] メチル、[2, 4-ジトリフルオロメチル-(3一、5一又は6一) ピリジル] メチル、2-(2, 4-ジフェニル-(3一、5一又は6一) ピリジル) エチル、3-[2-メチル-6-クロロ-(3一、4一又は5一) ピリジル] プロピル基等のピリジン環上に置換基として前記例示のハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基を1～3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基を例示できる。

【0195】

チオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるチエニル低級アルキル基としては、例えば、[(2一又は3一) チエニル] メチル、2-[(2一又は3一) チエニル] エチル、1-[(2一又は3一) チエニル] エチル、3-[(2一又は3一) チエニル] プロピル、4-[(2一又は3一) チエニル] ブチル、5-[(2一又は3一) チエニル] ペンチル、6-[(2一又は3一) チエニル] ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(2一又は3一) チエニル] エチル、2-メチル-3-[(2一又は3一) チエニル] プロピル、[2-クロロー(3, 4一又は5一) チエニル] メチル、[4-ブロモ-(2-, 3-又は5-) チエニル] メチル、[5-フルオロー(2-, 3-又は4-) チエニル] メチル、[3-ヨード-(2-, 4-又は5-) チエニル] メチル、[2, 3-ジクロロー(4-又は5-) チエニル] メチル、(2, 4, 5-トリクロロー-3-チエニル) メチル、2-[2-フルオロー(3-, 4-又は5-) チエニル] エチル、1-[4-ヨード-(2-, 3-又は5-) チエニル] エチル、3-[3-クロロー(2-, 4-又は5-) チエニル] プロピル、4-[4, 5-ジクロロー(2-又は3-) チエニル] ブチル、5-(2, 4, 5-トリクロロー-3-チエニル) ペンチル、6-[2-クロロー(3-, 4-又は5-) チエニル] ヘキシル基等のチオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるチエニルアルキル基を例示できる。

【0196】

低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、インブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、tert-ブチルカルボニルシアミノ、ヘキサノイルアミノ、N, N-ジアセチルアミノ、N-アセチル-N-ブロピオニルアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-ブロピルアミノ、イソブロピルアミノ、n-ブチルアミノ、n-ペンチルアミノ、n-ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、3-ジエチルアミノ、ジイソブロピルアミノ、N-エチル-N-n-ブロピルアミノ、N-メチル-N-n-ヘキシルアミノ、N-メチル-N-アセチルアミノ、N-エチル-N-アセチルアミノ基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群から選ばれた基を1～2個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0197】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基；シアノ基；ハロゲン原子を有することのある低級アルキル基；低級アルキル基及び低級アルカ

ノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基；ハロゲン原子；低級アルコキシカルボニル基；低級アルカノイルオキシ基；低級アルキルスルホニル基；低級アルキルチオ基及びピロリジニル基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、例えば、ベンジル、1-フェネチル、2-フェネチル、3-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、4-フェニルプロチル、5-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、2-メチル-3-フェニルプロピル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、1, 1-ジフェニルメチル、2, 2-ジフェニルエチル、3, 3-ジフェニルプロピル、1, 2-ジフェニルエチル、4-クロロベンジル、2-クロロベンジル、3-クロロベンジル、3-フルオロベンジル、4-フルオロベンジル、2-フルオロベンジル、4-ブロモベンジル、3-ブロモベンジル、2-ブロモベンジル、1-(2-クロロフェニル)エチル、2, 3-ジクロロベンジル、2, 4, 6-トリフルオロベンジル、2-トリフルオロメチルベンジル、3-トリフルオロメチルベンジル、4-トリフルオロメチルベンジル、2-メチルベンジル、3-メチルベンジル、4-メチルベンジル、4-tert-ブチルベンジル、4-n-ブチルベンジル、2, 4-ジメチルベンジル、2, 4, 6-トリメチルベンジル、2-フェニルベンジル、4-フェニルベンジル、2, 4-ジフェニルベンジル、2, 4, 6-トリフェニルベンジル、2-トリフルオロメトキシベンジル、3-トリフルオロメトキシベンジル、4-トリフルオロメトキシベンジル、4-ジフルオロメトキシベンジル、2-メトキシベンジル、3-メトキシベンジル、4-メトキシベンジル、4-n-ブトキシベンジル、4-tert-ブトキシベンジル、1-(3-メトキシフェニル)エチル、1-(4-メトキシフェニル)エチル、1-(2-メトキシフェニル)エチル、3, 4-ジメトキシベンジル、3, 4, 5-トリメトキシベンジル、4-メトキシカルボニルベンジル、3-エトキシカルボニルベンジル、2-n-ブロポキシカルボニルベンジル、2, 4-ジメトキシカルボニルベンジル、2, 4, 6-トリメトキシカルボニルベンジル、1-(4-n-ブトキシフェニル)エチル、4-tert-ブトキシカルボニルベンジル、4-メチルチオベンジル、3-メチルチオベンジル、2-メチルチオベンジル、4-エチルチオベンジル、2, 4-ジメチルチオベンジル、2, 4, 6-トリメチルチオベンジル、4-メチルスルホニルベンジル、3-メチルスルホニルベンジル、2-メチルスルホニルベンジル、3, 4-ジメチルスルホニルベンジル、3, 4, 5-トリメチルスルホニルベンジル、4-メトキシ-3-クロロベンジル、4-(N-アセチルアミノ)ベンジル、4-(N, N-ジエチルアミノ)ベンジル、4-(N, N-ジメチルアミノ)ベンジル、4-(N-メチルアミノ)ベンジル、3-アミノベンジル、2-アミノベンジル、4-アミノベンジル、4-アセチルオキシベンジル、2, 3-ジアミノベンジル、3, 4, 5-トリアミノベンジル、4-メチル-3-フルオロベンジル、4-シアノベンジル、3-シアノベンジル、2-シアノベンジル、4-(1-ピロリジニル)ベンジル、4-メトキシ-2-クロロベンジル、3-クロロ-5-メチルベンジル基等のフェニル環上に置換基として前記例示のハロゲン原子1~3個を有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基；シアノ基；前記例示のハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基；前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群から選ばれた基を1~2個有することのあるアミノ基；ハロゲン原子；前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基；前記例示の炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基；前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基；前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基及びピロリジニル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるフェニル基を1~2個有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0198】

チアゾリル低級アルキル基としては、例えば、[(2-、4-又は5-)チアゾリル]メチル、2-[(2-、4-又は5-)チアゾリル]エチル、1-[(2-、4-又は5-)チアゾリル]エチル、3-[(2-、4-又は5-)チアゾリル]プロピル、4-[(2-、4-又は5-)チアゾリル]ブチル、5-[(2-、4-又は5-)チアゾリル]

]] ペンチル、6-[(2-、4-又は5-) チアゾリル]] ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(2-、4-又は5-) チアゾリル] エチル、[2-メチル-3-[(2-、4-又は5-) チアゾリル] プロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるチアゾリルアルキル基を例示できる。

【0199】

イミダゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイミダゾリル低級アルキル基としては、例えば、[(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、2-[(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] エチル、1-[(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] プロピル、4-[(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] ブチル、1, 1-ジメチル-2-[(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] エチル、5-[(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] ペンチル、6-[(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] ヘキシル、1-[(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] イソプロピル、2-メチル-3-[(1-、2-、4-又は5-) イミダゾリル] プロピル、[1-メチル-(2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、[1-エチル-(2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、[1-n-プロピル-(2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、[1-n-ブチル-(2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、[1-n-ペンチル-(2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、[1-n-ヘキシル-(2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、2-[2-メチル-(1-、4-又は5-) イミダゾリル] エチル、1-[1-エチル-(2-、4-又は5-) イミダゾリル] エチル、3-[1-エチル-(2-、4-又は5-) イミダゾリル] メチル、4-[1-n-プロピル-(2-、4-又は5-) イミダゾリル] ブチル、5-[1-n-ブチル-(2-、4-又は5-) イミダゾリル] ペンチル、6-[1-n-ペンチル-(2-、4-又は5-) イミダゾリル] ヘキシル、[1, 2-ジメチル-(4-又は5-) イミダゾリル] メチル、(1, 2, 4-トリメチル-5-イミダゾリル) メチル基等のイミダゾール環上に置換基として前記例示の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるイミダゾリルアルキル基を例示できる。

【0200】

ピロール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピロリル低級アルキル基としては、例えば、[(1-、2-又は3-) ピロリル] メチル、2-[(1-、2-又は3-) ピロリル] エチル、1-[(1-、2-又は3-) ピロリル] エチル、3-[(1-、2-又は3-) ピロリル] プロピル、4-[(1-、2-又は3-) ピロリル] ブチル、1, 1-ジメチル-2-[(1-、2-又は3-) ピロリル] エチル、5-[(1-、2-又は3-) ピロリル] ペンチル、6-[(1-、2-又は3-) ピロリル] ヘキシル、1-[(1-、2-又は3-) ピロリル] イソプロピル、2-メチル-3-[(1-、2-又は3-) ピロリル] プロピル、[1-メチル-(2-又は3-) ピロリル] メチル、[1-エチル-(2-又は3-) ピロリル] メチル、[1-n-プロピル-(2-又は3-) ピロリル] メチル、[1-n-ブチル-(2-又は3-) ピロリル] メチル、[1-n-ペンチル-(2-又は3-) ピロリル] メチル、[1-n-ヘキシル-(2-又は3-) ピロリル] メチル、2-[2-メチル-(1-、3-、4-又は5-) ピロリル] エチル、1-[1-エチル-(2-又は3-) ピロリル] エチル、3-[1-エチル-(2-又は3-) ピロリル] メチル、4-[1-n-プロピル-(2-又は3-) ピロリル] ブチル、5-[1-n-ブチル-(2-又は3-) ピロリル] ペンチル、6-[1-n-ペンチル-(2-又は3-) ピロリル] ヘキシル、[1, 2-ジメチル-(3-、4-又は5-) ピロリル] メチル、[1, 2, 4-トリメチル-(3-又は5-) ピロリル] メチル基等のピロール環上に置換基として前記例示の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピロリルアルキル基を例示できる。

【0201】

低級アルキルチオ低級アルキル基としては、例えば、メチルチオメチル、2-メチルチオエチル、1-エチルチオエチル、2-エチルチオエチル、3-n-ブチルチオプロピル、4-n-ブロピルチオブチル、1, 1-ジメチル-2-n-ペンチルチオエチル、5-n-ヘキシルチオペンチル、6-メチルチオヘキシル、1-エチルチオイソプロピル、2-メチル-3-メチルチオブロピル基等の2つのアルキル部分が共に炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるアルキルチオアルキル基を例示できる。

【0202】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェノキシカルボニル基としては、例えば、フェノキシカルボニル、4-クロロフェノキシカルボニル、3-クロロフェノキシカルボニル、2-クロロフェノキシカルボニル、3, 4-ジクロロフェノキシカルボニル、2, 4, 6-トリクロロフェノキシカルボニル、4-フルオロフェノキシカルボニル、3-フルオロフェノキシカルボニル、2-フルオロフェノキシカルボニル、2, 4-ジフルオロフェノキシカルボニル、3, 4, 5-トリフルオロフェノキシカルボニル、4-プロモフェノキシカルボニル、2-クロロ-4-メトキシフェノキシカルボニル、3-フルオロ-5-メチルフェノキシカルボニル、4-メトキシフェノキシカルボニル、3-メトキシフェノキシカルボニル、2-メトキシフェノキシカルボニル、3, 4-ジメトキシフェノキシカルボニル、2, 4, 5-トリメトキシフェノキシカルボニル、4-メチルフェノキシカルボニル、3-メチルフェノキシカルボニル、2-メチルフェノキシカルボニル、2, 5-ジメチルフェノキシカルボニル、2, 3, 4-トリメチルフェノキシカルボニル基等のフェニル環上に置換基として前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、前記例示の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基を1～3個有することのあるフェノキシカルボニル基を例示できる。

【0203】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル、2-フェニルエトキシカルボニル、1-フェニルエトキシカルボニル、3-フェニルプロポキシカルボニル、4-フェニルブロキシカルボニル、5-フェニルベンチルオキシカルボニル、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシカルボニル、2-メチル-3-フェニルプロポキシカルボニル、2-クロロベンジルオキシカルボニル、3-クロロベンジルオキシカルボニル、2-クロロベンジルオキシカルボニル、3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル、4-フルオロベンジルオキシカルボニル、3-フルオロベンジルオキシカルボニル、2-フルオロベンジルオキシカルボニル、2, 4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル、4-プロモベンジルオキシカルボニル、4-ニトロベンジルオキシカルボニル、3-ニトロベンジルオキシカルボニル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲンを1～3個有することがあり、アルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0204】

キノキサリニルカルボニル基としては、例えば、2-キノキサリニルカルボニル、5-キノキサリニルカルボニル、6-キノキサリニルカルボニル基等を例示できる。

【0205】

フェニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-フェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、2-フェニルプロピオニル、4-フェニルブチリル、5-フェニルペントノイル、6-フェニルヘキサノイル、2, 2-ジメチル-2-フェニルブロピオニル、2-メチル-3-フェニルブロピオニル基等のアルカノイル部分が炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルであるフェニルアルカノイル基を例示できる。

【0206】

本発明の化合物は、例えば、下記反応式-1～反応式-16に示すようにして製造され

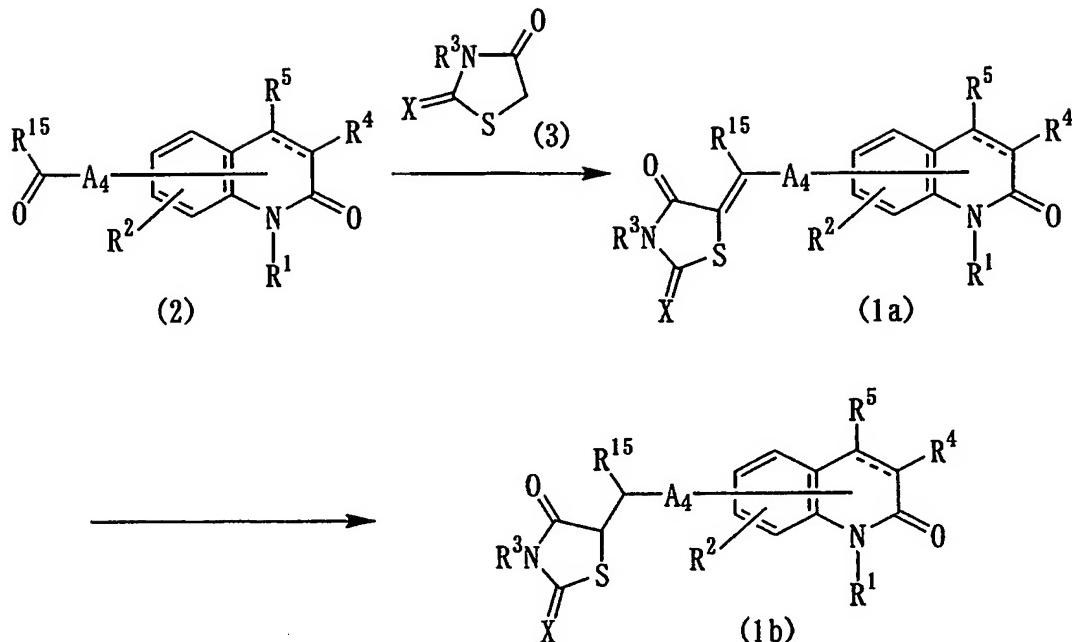
る。

【0207】

反応式-1

【0208】

【化3】



【0209】

[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、X及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。R¹⁵は、水素原子又は低級アルキル基を示す。A₄は、直接結合又は低級アルキレン基を示す。ここで、カルボスチリル骨格上に置換している基—CH(R¹⁵)—A₄—の総炭素数は6を超えないものとする。]

化合物(2)と化合物(3)との反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物又は酸の存在下に行われる。

【0210】

ここで使用される溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグラライム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチル磷酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0211】

塩基性化合物としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸セシウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、ナトリウムn-ブトキシド等の金属アルコラート類、ピペリジン、ピリジン、イミダゾール、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジメチルアニリン、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基又

はこれらの混合物を挙げることができる。

【0212】

酸としては、例えば、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸等脂肪酸等の有機酸、塩酸、硫酸、臭化水素酸、燐酸等の無機酸又はこれらの混合物を挙げることができる。

【0213】

本反応においては、塩基性化合物と酸とを併用してもよい。

【0214】

塩基性化合物又は酸は、化合物（2）に対して、通常触媒量、好ましくは、0.01～等モル量程度使用するのがよい。

【0215】

化合物（3）は、化合物（2）に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量程度使用するのがよい。

【0216】

該反応は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて行われ、一般に0.5～20時間程度にて反応は終了する。

【0217】

化合物（1a）を化合物（1b）に導く反応は、例えば、無溶媒又は適当な溶媒中、還元剤の存在下に行われる。

【0218】

ここで使用される溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、アセトニトリル、蟻酸、酢酸等の脂肪酸、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、N,N-ジメチルホルムアミド又はこれらの混合溶媒等を例示できる。

【0219】

還元剤としては、例えば、ジエチル-1,4-ジヒドロー-2,6-ジメチル-3,5-ピリジンジカルボキシレート等のピリジン化合物とシリコンジオキシドとの混合物、水素化硼素ナトリウム、水素化硼素リチウム、水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化トリアセチルオキシ硼素ナトリウム、水素化アルミニウムリチウム等の水素化還元剤又はこれらの水素化還元剤の混合物、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、酸化白金、白金黒、ラネニッケル等の接触水素還元剤等を例示できる。

【0220】

還元剤としてピリジン化合物とシリコンジオキシドとの混合物を使用する場合、反応温度は、通常室温～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度付近が適当であり、該反応は一般に0.5～50時間程度にて終了する。ピリジン化合物は、化合物（1a）に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～3倍モル量、シリコンジオキシドは、化合物（1a）に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～10倍モル量使用するのがよい。

【0221】

水素化還元剤を使用する場合、反応温度は、通常-80～100℃程度、好ましくは-80～70℃程度が適当であり、該反応は一般に30分～60時間程度で終了する。水素化還元剤は、化合物（1b）に対して、通常0.1倍モル～20倍モル量程度、好ましくは0.1倍モル～6倍モル程度用いられる。特に水素化還元剤として水素化アルミニウムリチウムを使用する場合、溶媒はジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類を使用するのが好ましい。該反応の反応系内に、ピリジン、トリメチルアミン、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン等のアミン類、水酸化ナトリウム等

の無機塩基又は／及びジメチルグリオキシム、2, 2'-ビピリジル、1, 10-フェナシスロリン等のリガンドの存在下、塩化第二コバルト、塩化第三コバルト、酢酸第二コバルト等のコバルト化合物を添加してもよい。

【0222】

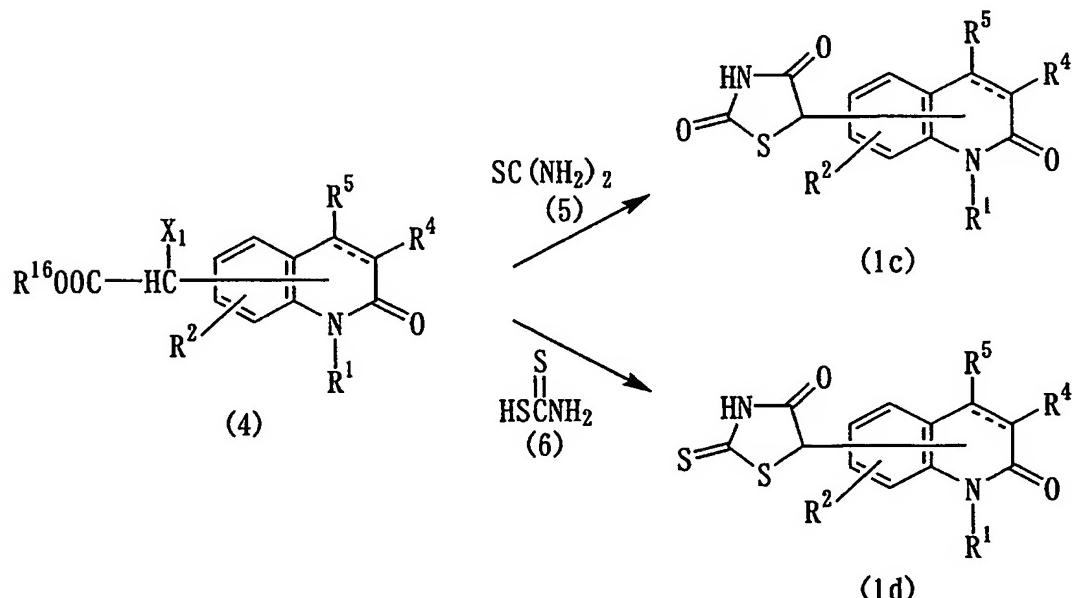
接触水素還元剤を使用する場合、通常常圧～20気圧程度、好ましくは常圧～10気圧程度の水素雰囲気中で、又は蟻酸、蟻酸アンモニウム、シクロヘキセン、包水ヒドラジン等の水素供与剤の存在下で、通常-30～100℃程度、好ましくは0～100℃程度の温度で反応を行うのがよい。該反応は、一般に1～12時間程度で終了する。接触水素還元剤は、化合物(1a)に対して、通常0.01～5倍重量、好ましくは1～3倍重量程度用いられる。

【0223】

反応式-2

【0224】

【化4】



【0225】

[式中、R¹、R²、R⁴、R⁵及びカルボスチリル骨格の3, 4位の結合は前記に同じ。R¹⁶は、低級アルキル基を示す。]

化合物(1c)は、化合物(4)と化合物(5)とを、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に反応させ、次いで得られる反応生成物を酸で処理する（この酸処理を、以下「酸処理A」という。）ことにより製造される。

【0226】

ここで使用される溶媒としては、例えば、水、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、2-メトキシエタノール、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソブロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N, N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチル燐酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0227】

塩基性化合物としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸セシウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水

酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、ナトリウムn-ブトキシド等の金属アルコラート類、酢酸ナトリウム、ピペリジン、ピリジン、イミダゾール、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジメチルアニリン、N-メチルモルホリン、DBN、DBU、DABCO等の有機塩基又はこれらの混合物を挙げることができる。

[0228]

塩基性化合物は、化合物（4）に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～3倍モル程度使用するのがよい。

[0229]

化合物(5)は、化合物(4)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～2倍モル程度使用するのがよい。

[0 2 3 0]

該反応は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて行われ、一般に0.5～10時間程度にて反応は終了する。

[0231]

得られる反応生成物を酸で処理する際に使用される酸としては、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の無機酸を例示できる。これらの酸は、処理すべき反応生成物に対して、通常大過剰量使用するのがよい。

[0 2 3 2]

酸処理の際に使用される溶媒としては、前記化合物（4）と化合物（5）の反応で使用される溶媒をいずれも使用することができる。

[0233]

酸処理は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて行われ、一般に0.5～30時間程度にて反応は終了する

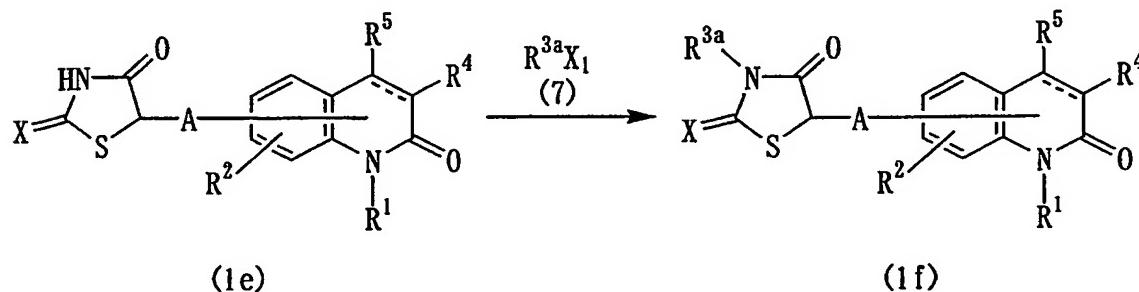
化合物(4)と化合物(6)との反応は、前記化合物(4)と化合物(5)との反応と同様の反応条件下に行われる。

〔0 2 3 4〕

反应式-3

[0235]

【化5】



[0236]

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、X、A及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。 X_1 はハロゲン原子を示す。 R^{3a} は、水素原子以外の前記 R^3 に定義されている基と同じ。]

化合物（1e）と化合物（7）との反応は、適当な不活性溶媒中、塩基性化合物の存在下に行われる。

[0237]

用いられる不活性溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、2-メトキシエタノール、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロ

ロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレンギリコール等の低級アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチル磷酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0238】

塩基性化合物としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸セシウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、ナトリウムn-ブトキシド、ナトリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ブトキシド等の金属アルコラート類、ピリジン、イミダゾール、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジメチルアニリン、N-メチルモルホリン、DBN、DBU、DABCO等の有機塩基又はこれらの混合物を挙げができる。

【0239】

塩基性化合物は、化合物(1e)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～10倍モル量使用するのがよい。

【0240】

化合物(7)は、化合物(1e)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～10倍モル量用いられる。

【0241】

該反応は、通常0～200℃、好ましくは0～150℃程度にて行われ、一般に5分～80時間程度にて反応は終了する。

【0242】

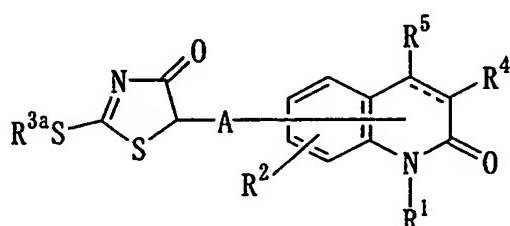
この反応の反応系内には、沃化ナトリウム、沃化カリウム等のアルカリ金属ハロゲン化合物等を添加してもよい。

【0243】

化合物(1e)と化合物(7)との反応において、Xが硫黄原子を示す化合物(1e)を用いる場合、該反応によって一般式

【0244】

【化6】



【0245】

[式中、R¹、R²、R⁴、R⁵、R^{3a}、A及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。]

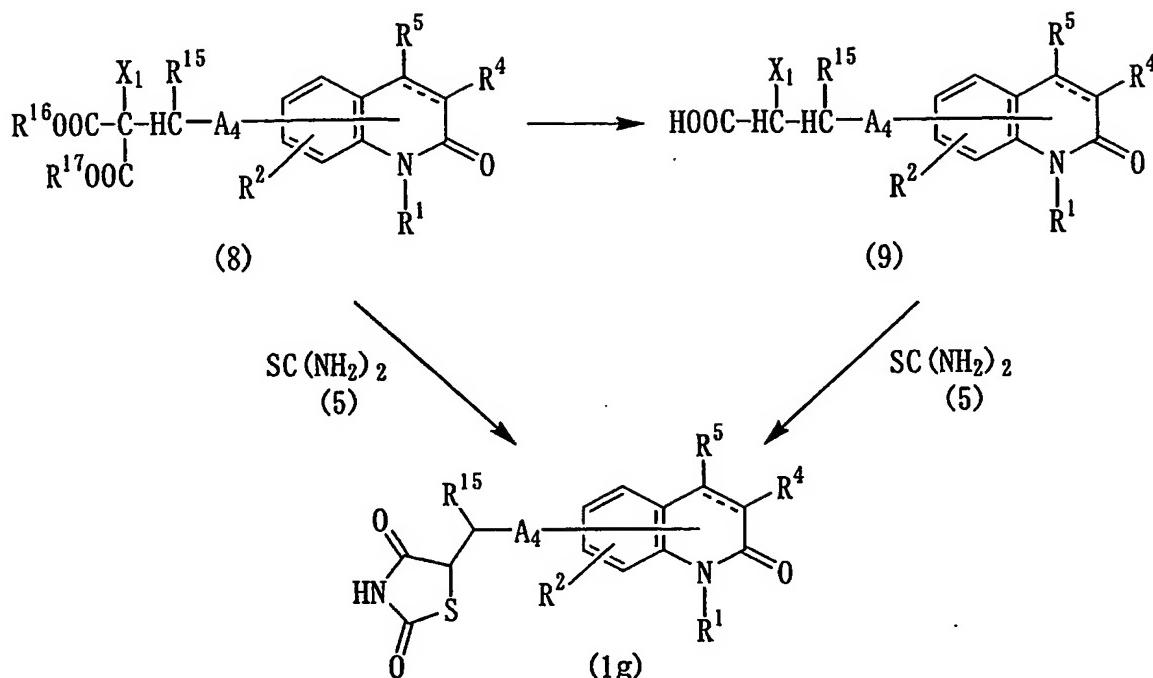
で表される化合物が生成することがあるが、該化合物は反応混合物から容易に単離され得る。

【0246】

反応式-4

【0247】

【化7】



【0248】

[式中、R¹、R²、R⁴、R⁵、A₄、R¹⁵、R¹⁶、X₁及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。R¹⁷は低級アルキル基を示す。]

化合物(8)を化合物(9)に導く反応は、化合物(8)を加水分解することにより行われる。

【0249】

この加水分解反応は、例えば、適当な溶媒中又は無溶媒で、酸又は塩基性化合物の存在下に行われる。

【0250】

用いられる溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、tert-ブタノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、酢酸、蟻酸等の脂肪族類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭素類、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチル磷酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0251】

酸としては、例えば、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸及び蟻酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸等の有機酸を挙げることができる。これらの酸は、1種単独で又は2種以上混合して用いられる。

【0252】

塩基性化合物としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化リチウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。これらの塩基性化合物は、1種単独で又は2種以上混合して用いられる。

【0253】

加水分解反応は、通常0～200℃程度、好ましくは0～150℃程度にて好適に進行し、一般に10分～30時間程度で終了する。

【0254】

化合物(1g)は、化合物(8)と化合物(5)とを、適当な溶媒中、塩基性化合物の
出証特2005-3094054

存在下又は非存在下に反応させ、次いで得られる反応生成物を酸で処理することにより製造される。また、化合物(1 g)は、化合物(9)と化合物(5)とを、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下に反応させ、次いで得られる反応生成物を酸で処理することにより製造される。

【0255】

化合物(8)と化合物(5)との反応及び化合物(9)と化合物(5)との反応において、使用される溶媒としては、スルホランに加えて、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(5)の反応で用いられる溶媒をいずれも使用することができる。

[0256]

塩基性化合物としては、前記反応式-2における化合物(4)と化合物(5)で用いた塩基性化合物をいずれも使用することができる。

[0257]

塩基性化合物は、化合物（5）に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～2倍モル量使用するのがよい。化合物（8）又は化合物（9）は、化合物（5）に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。

[0258]

該反応は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて行われ、一般に0.5～10時間程度にて反応は終了する。

[0259]

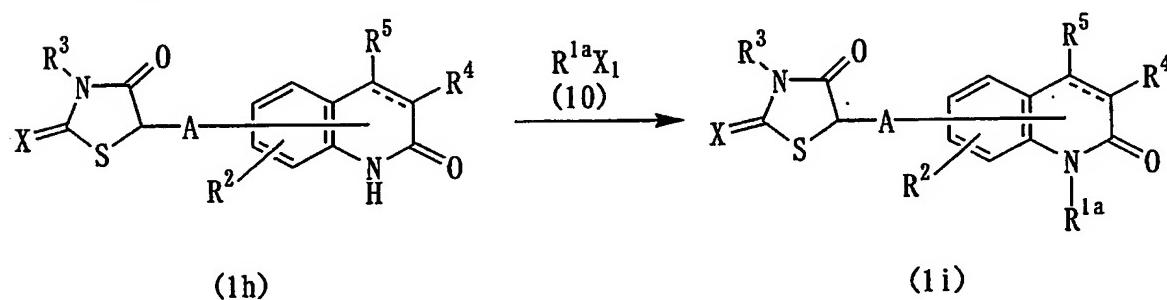
引き続き行われる酸処理は、前記反応式-2における「酸処理A」の条件と同様の処理条件下に行われる。

[0260]

反应式-5

[0261]

【化8】



[0262]

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、A、 X_1 及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。 R^{1a} は、水素原子以外の前記 R^1 に定義されている基と同じ。]

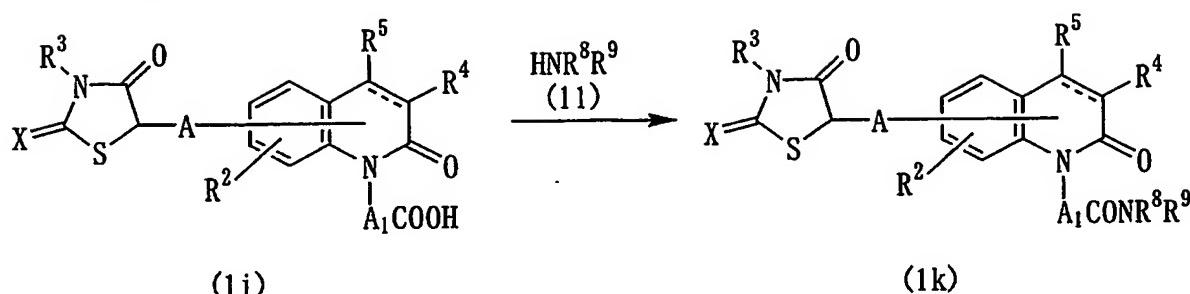
化合物(1h)と化合物(10)との反応は、前記反応式-3における化合物(1e)と化合物(7)との反応と同様の反応条件下に行われる。

[0263]

反応式-6

[0264]

【化9】



(1j)

(1k)

【0265】

[式中、R²、R³、R⁴、R⁵、X、A、R⁸、R⁹、A₁及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。]

化合物(1j)と化合物(11)との反応には、通常のアミド結合生成反応の反応条件を広く適用することができる。具体的には、(イ)混合酸無水物法、即ちカルボン酸(1j)にアルキルハロカルボン酸を反応させて混合酸無水物とし、これにアミン(11)を反応させる方法、(ロ)活性エステル法、即ちカルボン酸(1j)をフェニル、p-ニトロフェニルエステル、N-ヒドロキシコハク酸イミドエステル、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールエステル等の活性エステル、又はベンズオキサゾリン-2-チオンとの活性アミドとし、これにアミン(11)を反応させる方法、(ハ)カルボジイミド法、即ちカルボン酸(1j)にアミン(11)をジシクロヘキシリカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド(WSC)、カルボニルジイミダゾール等の活性化剤の存在下に縮合反応させる方法、(ニ)その他の方法、例えばカルボン酸(1j)を無水酢酸等の脱水剤によりカルボン酸無水物とし、これにアミン(11)を反応させる方法、カルボン酸(1j)と低級アルコールとのエステルにアミン(11)を高圧高温下に反応させる方法、カルボン酸(1j)の酸ハロゲン化物、即ちカルボン酸ハライドにアミン(11)を反応させる方法等を挙げることができる。

【0266】

上記混合無水物法(イ)において用いられる混合酸無水物は、通常のショッテン-バウマン反応により得られ、これを通常単離することなくアミン(11)と反応させることにより一般式(1k)の化合物が製造される。

【0267】

上記ショッテン-バウマン反応は、塩基性化合物の存在下に行われる。

【0268】

用いられる塩基性化合物としては、ショッテン-バウマン反応に慣用の化合物、例えば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、DBN、DBU、DABCO等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基が挙げられる。これらの塩基性化合物は、1種単独で又は2種以上混合して用いられる。該反応は、通常-20~100℃程度、好ましくは0~50℃程度において行われ、反応時間は5分~10時間程度、好ましくは5分~2時間程度である。

【0269】

得られた混合酸無水物とアミン(11)との反応は、通常-20~150℃程度、好ましくは10~50℃程度にて行われ、反応時間は5分~10時間程度、好ましくは5分~5時間程度である。

【0270】

混合酸無水物法は一般に溶媒中で行われる。用いられる溶媒としては混合酸無水物法に

慣用されている溶媒がいずれも使用可能であり、具体的には、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、N, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチル磷酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

【0271】

混合酸無水物法において使用されるアルキルハロカルボン酸としては、例えば、クロロ蟻酸メチル、プロモ蟻酸メチル、クロロ蟻酸エチル、プロモ蟻酸エチル、クロロ蟻酸イソブチル等が挙げられる。

【0272】

混合酸無水物法におけるカルボン酸（1 j）とアルキルハロカルボン酸とアミン（1 l）の使用割合は、通常等モルずつとするのがよいが、カルボン酸（1 j）に対してアルキルハロカルボン酸及びアミン（1 l）をそれぞれ等モル～1.5倍モル量程度の範囲内で使用することができる。

【0273】

前記活性化剤の存在下に縮合反応させる方法（ハ）においては、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下に行われる。ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、下記その他の方法（ニ）のカルボン酸ハライドにアミン（1 b）を反応させる方法で用いた溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。活性化剤の使用量は、化合物（1 j）に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量とするのがよい。活性化剤としてWSCを使用する場合は、反応系内に1-ヒドロキシベンゾトリアゾールを添加することにより、反応を有利に進行させることができる。該反応は、通常-20～180℃程度、好ましくは0～150℃程度にて行われ、一般に5分～90時間程度で反応は完結する。

【0274】

また前記その他の方法（ニ）の内で、カルボン酸ハライドにアミン（1 l）を反応させる方法を採用する場合、該反応は塩基性化合物の存在下に、適当な溶媒中で行われる。用いられる塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば上記ショッテン-バウマン反応に用いられる塩基性化合物をいずれも使用することができる。溶媒としては、例えば上記混合酸無水物法に用いられる溶媒の他に、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水等を挙げることができる。カルボン酸ハライドとアミン（1 l）との使用割合としては、特に限定がなく広い範囲内で適宜選択すればよいが、通常前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル～5倍モル量程度とするのがよい。該反応は通常-20～180℃程度、好ましくは0～150℃程度にて行われ、一般に5分～30時間程度で反応は完結する。

【0275】

更に上記反応式-6に示すアミド結合生成反応は、カルボン酸（1 j）とアミン（1 l）とを、トリフェニルホスフィン、ジフェニルホスフィニルクロリド、フェニル-N-フェニルホスホラミドクロリデート、ジエチルクロロホスフェート、シアノリン酸ジエチル、ジフェニルリン酸アジド、ビス（2-オキソ-3-オキサゾリジニル）ホスフィニッククロリド等の鱗化合物の縮合剤の存在下に反応させる方法によっても行うことができる。前記縮合剤は、1種単独で又は2種以上混合して用いられる。

【0276】

該反応は、上記カルボン酸ハライドにアミン（1 l）を反応させる方法において用いられる溶媒及び塩基性化合物の存在下に、通常-20～150℃程度、好ましくは0～100℃程度付近にて行われ、一般に5分～30時間程度にて反応は終了する。縮合剤及びアミン（1 l）は、カルボン酸（1 j）に対してそれぞれ少なくとも等モル量程度、好まし

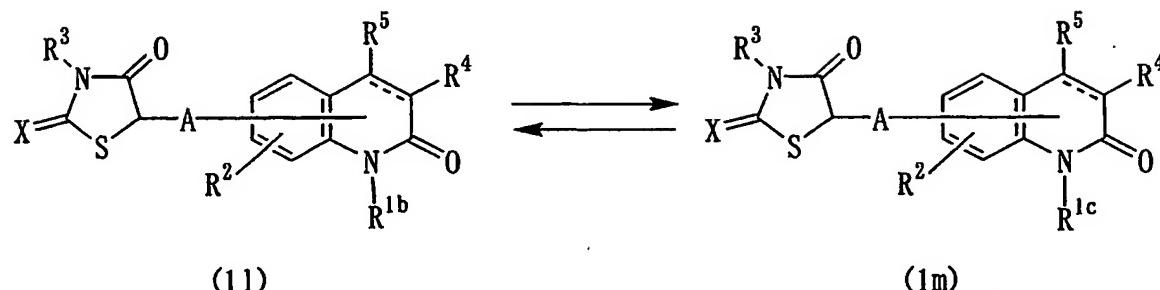
くは等モル～2倍モル量程度使用するのがよい。

[0277]

反应式-7

[0278]

【化10】



[0279]

[式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、A及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。 R^{1b} は、前記 R^1 の(1-9)で定義されている基と同じ。 R^{1c} は、前記 R^1 の(1-8)で定義されている基と同じ。]

化合物(11)を化合物(1m)に導く反応は、前記反応式-4における化合物(8)を化合物(9)に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

〔0280〕

化合物 (1 m) を化合物 (1 l) に導く反応は、化合物 (1 m) と一般式
 $R^{23}OH$ (50)

[式中、R²³は、低級アルキル基を示す。]

で表される化合物と反応させることにより行われる。

[0281]

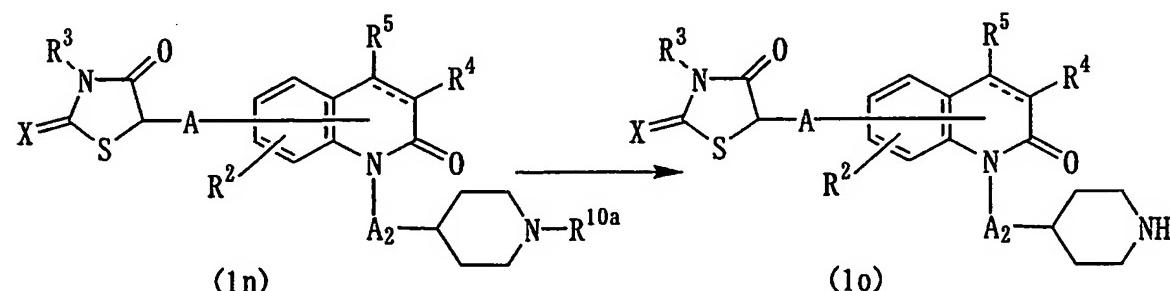
この反応には、通常のエステル化反応条件をいずれも適用することができる。例えば、該反応は、塩酸、硫酸等の鉱酸、チオニルクロリド、オキシ塩化燐、五塩化燐、三塩化燐等のハロゲン化剤の存在下で行われる。化合物(50)は、化合物(1m)に対して、大過剰量使用される。該反応は、通常0~150℃、好ましくは50~100℃程度にて好適に進行し、一般に1~10時間程度で終了する。

[0282]

反应式-8

[0283]

[化 11]



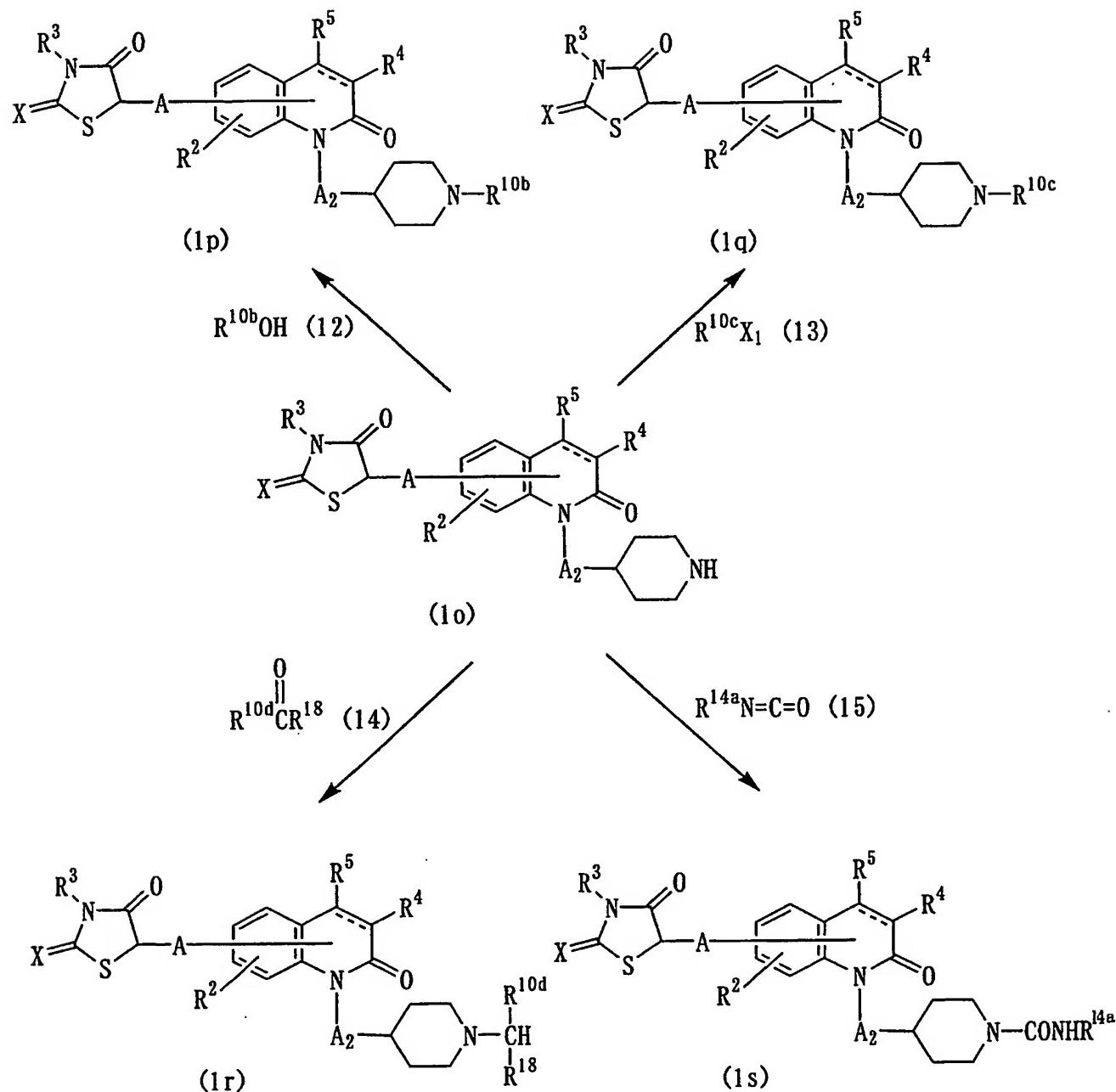
[0284]

[式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、A、A₂及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。 R^{10a} は、前記R¹⁰の(7-3)で定義されている基と同じ。]

化合物(1n)を化合物(1o)に導く反応は、前記反応式-4における化合物(8)を化合物(9)に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

【0285】

反応式-9
【0286】
【化12】



【0287】

[式中、R²、R³、R⁴、R⁵、X、A、A₂、X₁及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。]

R^{10b}は、前記R¹⁰の(7-3)～(7-7)、(7-9)～(7-20)及び(7-30)～(7-35)で定義されている基と同じ。

R^{10c}は前記R¹⁰の(7-2)、(7-8)、(7-21)～(7-29)及び(7-37)～(7-41)で定義されている基と同じ。

R^{10d}は、前記R¹⁰の(7-1)、(7-2)、(7-21)～(7-29)及び(7-40)で定義されている基；フリル基；ピリジン環上に置換基として低級アルキル基（ハロゲン原子が置換していてよい）及びハロゲン原子なる群から選ばれた基を有することのあるピリジル基；チオフェン環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるチエニル基；フェニル環上に置換基

として低級アルコキシ基（ハロゲン原子が置換していてもよい）、シアノ基、低級アルキル基（ハロゲン原子が置換していてもよい）、アミノ基（低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい）、ハロゲン原子、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイルオキシ基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキルチオ基及びピロリジニル基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル基；チアジリル基；イミダゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイミダゾリル基；ピロール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピロリル基又はシクロアルキル基を示す。

R^{14a} は、前記 R^{14} の(10-1)～(10-3)で定義されている基と同じ。

R^{18} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

但し、化合物(1r)における基 $CH(R^{10d})R^{18}$ の総炭素数は6を超えないものとする。]

化合物(1o)と化合物(12)との反応は、前記反応式-6における化合物(1j)と化合物(11)との反応と同様の反応条件下に行われる。但し、この反応では、アルキルハロカルボン酸、カルボン酸(12)、活性化剤、縮合剤、カルボン酸ハライド等の化合物の使用量は、化合物(1o)に対してである。

【0288】

化合物(1o)と化合物(13)との反応は、前記反応式-3における化合物(1e)と化合物(7)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0289】

化合物(1o)と化合物(14)との反応は、例えば、無溶媒又は適当な溶媒中、還元剤の存在下に行われる。

【0290】

ここで使用される溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、アセトニトリル、蟻酸、酢酸等の脂肪酸、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類又はこれらの混合溶媒等を例示できる。

【0291】

還元剤としては、例えば、蟻酸等の脂肪酸、蟻酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、水素化硼素ナトリウム、水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化トリアセチルオキシ硼素ナトリウム、水素化アルミニウムリチウム等の水素化還元剤又はこれらの水素化還元剤の混合物、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、酸化白金、白金黒、ラネニッケル等の接触水素還元剤等を例示できる。

【0292】

還元剤として蟻酸等の脂肪酸、蟻酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩を使用する場合、反応温度は、通常室温～200℃程度、好ましくは50～150℃程度付近が適当であり、該反応は一般に10分～10時間程度にて終了する。脂肪酸又は脂肪酸アルカリ金属塩は、化合物(1o)に対して大過剰量使用するのがよい。

【0293】

水素化還元剤を使用する場合、反応温度は、通常-80～100℃程度、好ましくは-80～70℃程度が適当であり、該反応は一般に30分～60時間程度で終了する。水素化還元剤は、化合物(1o)に対して、通常等モル～20倍モル量程度、好ましくは等モル～6倍モル程度用いられる。特に水素化還元剤として水素化アルミニウムリチウムを使用する場合、溶媒はジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類を使用するのが好ましい。該反応の反応系内に、トリメチルアミン、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン等のアミン類、又はモレキュラーシーヴス 3A (MS-3A)、モレキュラーシーヴス 4A (MS-4A) 等のモレキュラーシーヴスを添加して

もよい。

【0294】

接触水素還元剤を使用する場合、通常常圧～20気圧程度、好ましくは常圧～10気圧程度の水素雰囲気中で、又は蟻酸、蟻酸アンモニウム、シクロヘキセン、包水ヒドラジン等の水素供与剤の存在下で、通常-30～100℃程度、好ましくは0～60℃程度の温度で反応を行うのがよい。該反応は、一般に1～12時間程度で終了する。接触水素還元剤は、化合物(1o)に対して、通常0.1～40重量%、好ましくは1～20重量%程度用いられる。

【0295】

化合物(1o)と化合物(14)との反応において、化合物(14)は、化合物(1o)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～大過剰量用いられる。

【0296】

化合物(1o)と化合物(15)との反応は、塩基性化合物の存在下又は非存在下、好ましくは非存在下に、適当な不活性溶媒又は無溶媒下で行われる。

【0297】

不活性溶媒及び塩基性化合物は、前記化合物(1o)と化合物(12)との反応(アミド結合生成反応)のうち、方法(二)のカルボン酸ハライドにアミン(1o)を反応させる際に用いられる溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。

【0298】

化合物(15)の使用量は、化合物(1o)に対して、通常等モル～5倍モル量程度、好ましくは等モル～3倍モル量程度とするのがよい。

【0299】

該反応は、通常0～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度付近で好適に進行し、通常5分～30時間程度で終了する。

【0300】

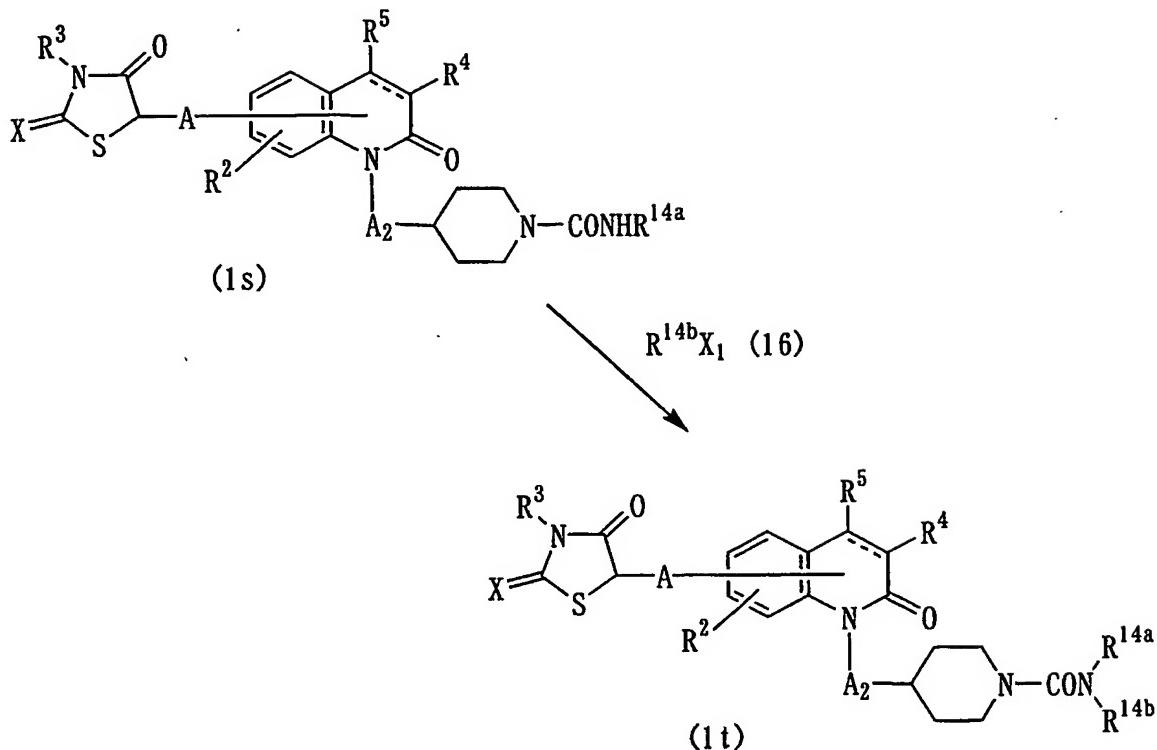
該反応の反応系内には、三弗化硼素ジエチルエーテル錯体等の硼素化合物を添加してもよい。

【0301】

反応式-10

【0302】

【化 1 3】



【0 3 0 3】

[式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、A、 A_2 、 X_1 、 R^{14a} 及びカルボスチリル骨格の3, 4位の結合は前記に同じ。 R^{14b} は、前記 R^{14} の(10-2)又は(10-3)で定義されている基と同じ。]

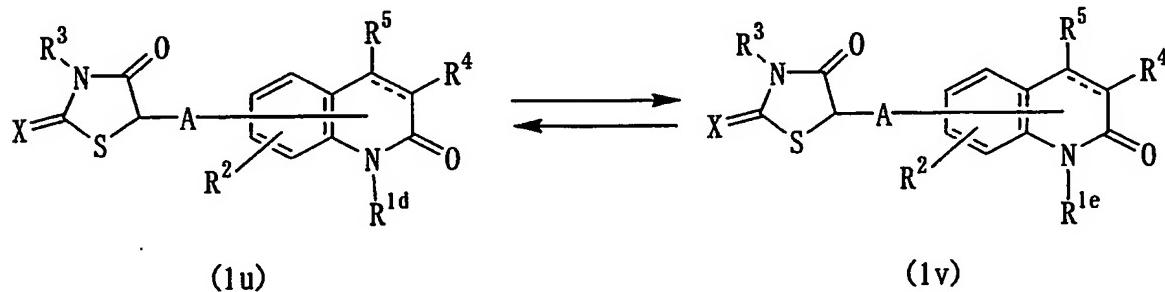
化合物(1 s)と化合物(16)との反応は、前記反応式-3における化合物(1 e)と化合物(7)との反応と同様の反応条件下に行われる。

[0304]

反应式-11

【0305】

【化 1 4】



【0306】

[式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、A及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。 R^{1d} は、フェニル環上に低級アルコキシカルボニル基を少なくとも1個有している以外は、前記 R^1 の(1-3)で定義されている基と同じ。 R^{1e} は、フェニル環上にカルボキシ基を少なくとも1個有している以外は、前記 R^1 の(1-3)で定義されている基と同じ。]

化合物 (1 u) を化合物 (1 v) に導く反応は、前記反応式-4 における化合物 (8) を化合物 (9) に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

【0307】

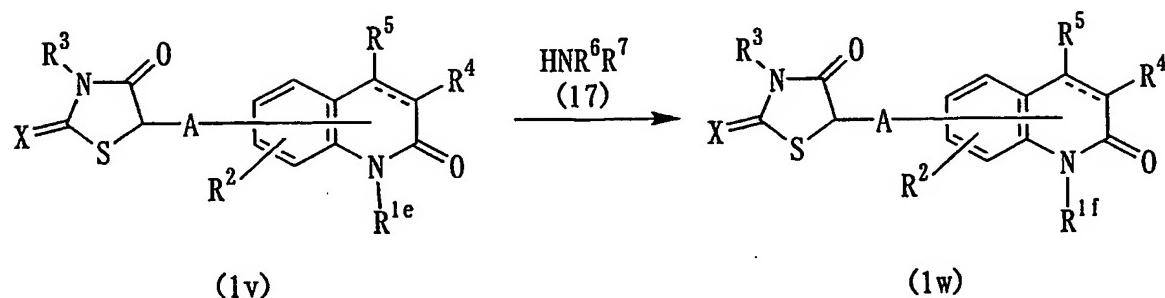
化合物 (1 v) を化合物 (1 u) に導く反応は、前記反応式-7における化合物 (1 m) を化合物 (1 l) に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

[0308]

反應式-12

[0309]

【化 15】



[0 3 1 0]

[式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、A、 R^6 、 R^7 、 R^{1e} 及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。 R^{1f} は、フェニル環上に基-CO NR⁶ R⁷を少なくとも1個有している以外は、前記R¹の(1-3)で定義されている基と同じ。]

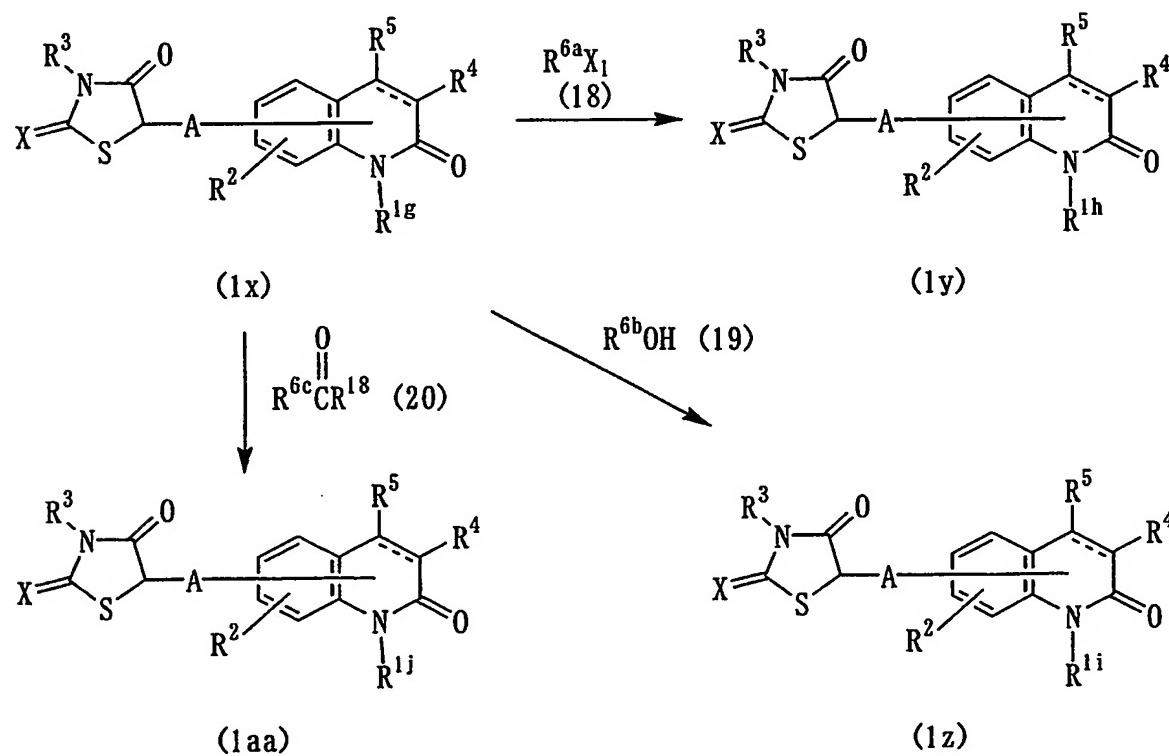
化合物 (1 v) と化合物 (1 7) との反応は、前記反応式-6 における化合物 (1 j) と化合物 (1 1) との反応と同様の反応条件下に行われる。

[0 3 1 1]

反应式-1.3

[0312]

[化16]



[0 3 1 3]

[式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、A、 X_1 、 R^{18} 及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。]

R^{1g} は、フェニル環上に基-（B）₁NH R^{7a} を少なくとも1個有している以外は、前記 R^1 の(1-3)で定義されている基と同じ。ここで1は前記に同じ。

R^{1h} は、フェニル環上に基- (B)₁N (R^{6a}) R^{7a}を少なくとも1個有している以外は、前記R¹の(1-3)で定義されている基と同じ。

R^{1i} は、フェニル環上に基一（B）₁N（R^{6b}）R^{7a}を少なくとも1個有している以外は、前記R₁の(1-3)で定義されている基と同じ。

R^{1j} は、フェニル環上に基- (B) ₁N [CH (R^{6c}) R¹⁸] R^{7a}を少なくとも 1 個有している以外は、前記 R 1 の(1-3)で定義されている基と同じ。但し、基 [CH (R^{6c}) R⁸] の総炭素数は 6 を超えないものとする。

は前記に同じ。

R^{7a} は、前記 R^7 の(4-1)～(4-79)で定義されている基と同じ。

R^{6a}は、前記R⁶の(4-2)、(4-4)、(4-6)、(4-8)～(4-11)、(4-19)～(4-32)、(4-34)～(4-37)、(4-60)、(4-62)～(4-72)、(4-78)又は(4-79)で定義されている基と同じ。

R^6 は、前記 R^6 の(4-3)、(4-5)、(4-7)、(4-12)～(4-18)、(4-33)、(4-38)～(4-59)、(4-61)、(4-73)～(4-77)で定義されている基と同じ。

R^{6c} は、前記 R^6 の(4-1)、(4-2)、(4-6)、(4-9)、(4-20)、(4-21)、(4-23)～(4-29)、(4-31)、(4-32)、(4-34)で定義されている基；ピリジル基；テトラヒドロピラニル基；シクロアルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルキル基（ハロゲン原子が置換していてもよい）、低級アルコキシ基（ハロゲン原子が置換していてもよい）及び水酸基なる群から選ばれた基を有することがあるフェニル基；低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル基；フリル基；イミダゾリル基；ピロリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピロリジニル基又はモルホリノ基を示す。]

化合物(1x)と化合物(18)との反応は、前記反応式-9における化合物(1o)と化合物(12)との反応と同様の反応条件下に行われる。

[0 3 1 4]

化合物(1x)と化合物(19)との反応は、前記反応式-9における化合物(1o)と化合物(13)との反応と同様の反応条件下に行われる。

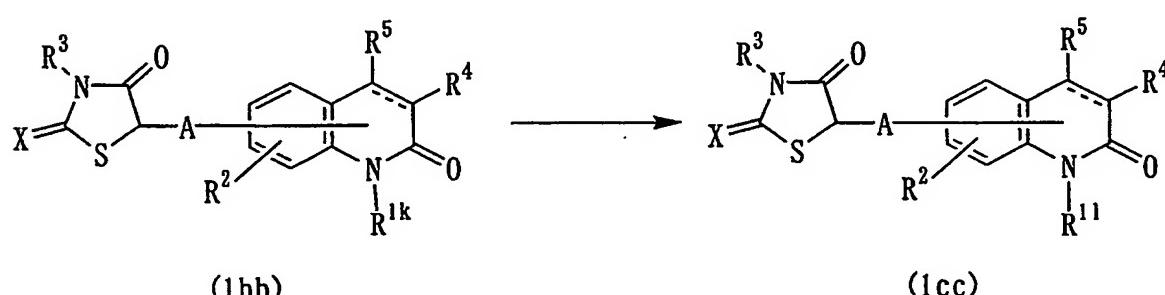
[0315]

化合物(1x)と化合物(20)との反応は、前記反応式-9における化合物(1o)と化合物(14)との反応と同様の反応条件下に行われる。

[0316]

反应式-14

[0317]



[0318]

[式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、A及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。 R^{1k} は、フェニル環上にニトロ基を少なくとも1個有している以外は、前記 R^1 の(1-3)で定義されている基と同じ。 R^{11} は、フェニル環上にアミノ基を少なくとも1個有している以外は、前記 R^1 の(1-3)で定義されている基と同じ。]

化合物(1b b)を化合物(1c c)に導く反応は、例えば、(1)適当な溶媒中、接触水素還元剤を用いて化合物(1b b)を還元するか、又は(2)適当な不活性溶媒中、金属

もしくは金属塩と酸又は金属もしくは金属塩とアルカリ金属水酸化物、硫化物、アンモニウム塩等との混合物を還元剤として用いて化合物(1bb)を還元することにより行われる。

【0319】

上記(1)の方法を採用する場合、溶媒としては、例えば、水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、n-ヘキサン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、N,N-ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒等又はこれらの混合溶媒等を使用できる。接触水素還元剤としては、例えば、パラジウム、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、白金-炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ラネニッケル等を使用できる。これらの還元剤は、1種単独で又は2種以上混合して用いられる。還元剤は、化合物(1bb)に対して、一般に0.02~1倍重量程度用いるのがよい。反応温度は、通常-20~150°C付近、好ましくは0~100°C付近、水素圧は通常1~10気圧とするのがよく、該反応は一般に0.5~100時間程度で終了する。該反応の反応系内には塩酸等の酸を添加してもよい。

【0320】

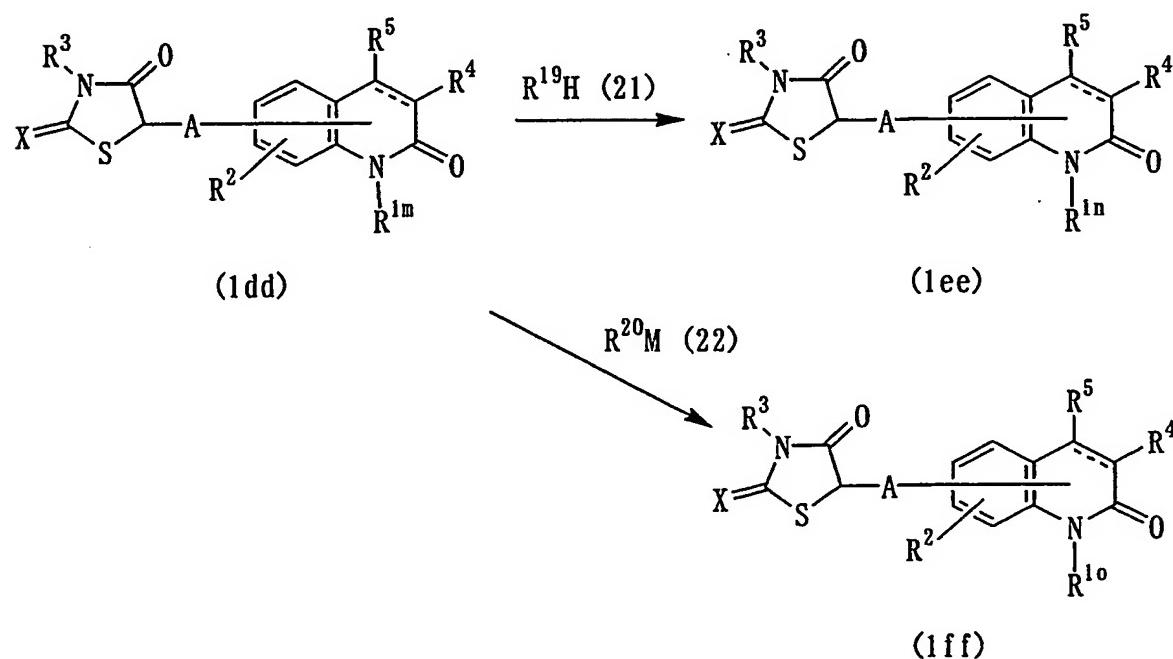
(2)の方法を採用する場合、鉄、亜鉛、錫もしくは塩化第一錫と塩酸、硫酸等の鉱酸、又は鉄、硫酸第一鉄、亜鉛もしくは錫と水酸化ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物、硫化アンモニウム等の硫化物、アンモニア水、塩化アンモニウム等のアンモニウム塩との混合物が還元剤として用いられる。不活性溶媒としては、例えば、水、酢酸、メタノール、エタノール等のアルコール類、ジオキサン等のエーテル類等又はこれらの混合溶媒等を例示できる。還元反応の条件としては、用いられる還元剤によって適宜選択すればよく、例えば塩化第一錫と塩酸とを還元剤として用いる場合、有利には0°C~150°C付近、0.5~10時間程度反応を行なうのがよい。上記還元剤は、化合物(1bb)に対して、少なくとも等モル量、通常は等モル~5倍モル量用いられる。

【0321】

反応式-15

【0322】

【化18】



【0323】

[式中、R²、R³、R⁴、R⁵、X、A及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。]

R^{1^m}は、ピリジン環上にハロゲン原子を少なくとも1個有している以外は、前記R¹の(1-10)で定義されている基と同じ。

R^{1ⁿ}は、ピリジン環上にピペリジニル基；モルホリノ基；ピペラジン環上に置換基としてフェニル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペラジニル基並びにアミノ基上に低級アルキル基を有することのあるアニリノ基を少なくとも1個有している以外は、前記R¹の(1-10)で定義されている基と同じ。

R^{1^o}は、チエニル基、フェニル基又はピリジル基を少なくとも1個有している以外は、前記R¹の(1-10)で定義されている基と同じ。

R^{1^g}は、ピペリジニル基、モルホリノ基、ピペラジン環上に置換基としてフェニル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペラジニル基又はアミノ基上に低級アルキル基を有することのあるアニリノ基を示す。

R^{2^o}は、チエニル基、フェニル基又はピリジル基を示す。

Mは、リチウム、カリウム、ナトリウム等のアルカリ金属、基-Mg X₁ (X₁は前記に同じ) 又は基-B(OH)₂を示す。]

化合物(1 d d)と化合物(2 1)との反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物及び触媒の存在下に行われる。

【0324】

ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、前記反応式-3における化合物(1 e)と化合物(7)の反応で用いた溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。

【0325】

触媒としては、例えば、ビス(トリプチル錫)/ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム、R-トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム、S-トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム、パラジウム(II)アセテート等のパラジウム化合物、R-2, 2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1, 1'-ビナフチル(R-BINAP), S-2, 2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1, 1'-ビナフチル(S-BINAP)、RAC-2, 2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1, 1'-ビナフチル(RAC-BINAP)、2, 2-ビス(ジフェニルイミダゾリディニリデン)等の化合物、4, 5-ビス(ジフェニルホスフィノ)-9, 9-ジメチルキサンテン等のキサンテン化合物、tert-ブチルホスフィン、tert-ブチルホスフィンテトラフルオロホウ酸塩等のアルキルホスフィン又はその塩等又はこれらの混合物等を挙げることができる。

【0326】

塩基性化合物は、化合物(1 d d)に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル~2倍モル量使用するのがよい。

【0327】

触媒は、化合物(1 d d)に対して、通常の触媒量で使用するのがよい。

【0328】

化合物(2 1)は、化合物(1 d d)に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル~2倍モル量使用するのがよい。

【0329】

該反応は、通常室温~200℃、好ましくは室温~150℃付近にて行われ、一般に0.5~20時間程度にて終了する。

【0330】

化合物(1 d d)と化合物(2 2)との反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物及び触媒の存在下に行われる。

【0331】

ここで使用される溶媒としては、水に加えて、前記反応式-3における化合物(1 e)と化合物(7)との反応で用いた溶媒をいずれも使用することができる。

[0 3 3 2]

塩基性化合物としては、前記反応式-3における化合物(1e)と化合物(7)との反応で用いた塩基性化合物をいずれも使用することができる。

[0 3 3 3]

触媒としては、例えば、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)等のパラジウム化合物を挙げることができる。

[0 3 3 4]

塩基性化合物は、化合物（1 d d）に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。

[0335]

触媒は、化合物（1 d d）に対して、通常0.001～等モル量、好ましくは0.01～0.5倍モル量使用するのがよい。

103361

化合物(21)は、化合物(1dd)に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。

[0 3 3 7]

該反応は、通常-30~200°C、好ましくは0~150°C付近にて行われ、一般に0.5~2.0時間程度にて終了する。

J - 20 時間
10 3 3 8 1

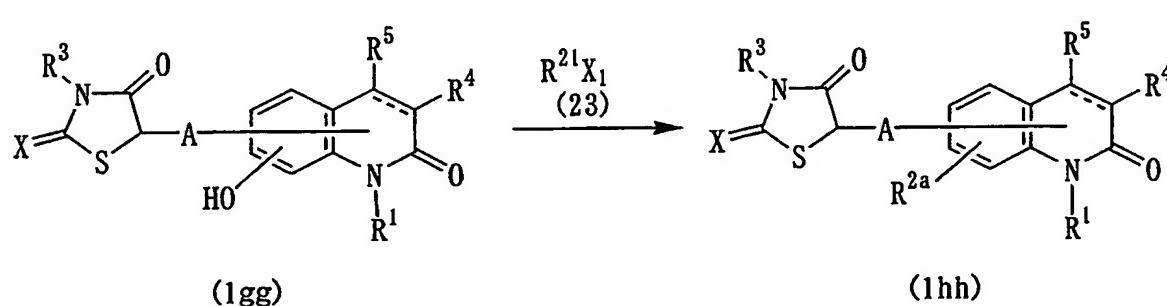
該反応において、Mがアルカリ金属塩又は MgX_1 を示す場合は、塩基性化合物及び触媒の非存在下でも反応は進行する。

10330V

10339

及心式—T

03401



[0 3 4 1]

[式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、X、A、 X_1 及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。]

R^2 は、前記 R^2 の(2-2)、(2-4)、(2-5)、(2-7)～(2-32)で定義されている基と同じ。

R^{21} は、低級アルキル基；カルボキシ低級アルキル基；低級アルコキシカルボニル低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルキル基（ハロゲン原子が置換していてもよい）、低級アルキルチオ基（ハロゲン原子が置換していてもよい）、低級アルコキシ基、ニトロ基、低級アルキルスルホニル基、低級アルコキシカルボニル基、フェニル低級アルケニル基、低級アルカノイルオキシ基及び 1, 2, 3-チオジアゾリル基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基；ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル低級アルキル基；低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基；低級アルケニル基；ピリジン環上に置換基として低級アルキル基（ハロゲン原子が置換していてもよい）を有することのあるピリジル低級アルキル基；低級アルキニル基；フェニル低級アルキニル基；フェニル低級アルケニル基；フラン環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基を有することの

あるフリル低級アルキル基；テトラゾール環上に置換基としてフェニル低級アルキル基、フェニル基及びシクロアルキル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるテトラゾリル低級アルキル基；1, 2, 4-オキサジアゾール環上に置換基としてフェニル基（低級アルキル基が置換していてもよい）を有することのある1, 2, 4-オキサジアゾリル低級アルキル基；イソオキサゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるイソオキサゾリル低級アルキル基；1, 3, 4-オキサジアゾール環上に置換基としてフェニル基（低級アルキル基が置換していてもよい）を有することのある1, 3, 4-オキサジアゾリル低級アルキル基；低級アルカノイル低級アルキル基；チアゾール環上に置換基としてフェニル基（ハロゲン原子が置換していてもよい）及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるチアゾリル低級アルキル基；ピペリジン環上に置換基としてベンゾイル基（ハロゲン原子が置換していてもよい）を有することのあるピペリジニル基；チエニル低級アルキル基；フェニルチオ低級アルキル基；低級アルキル基を有することのあるカルバモイル置換低級アルキル基；ベンゾイル低級アルキル基；ピリジルカルボニル低級アルキル基；イミダゾール環上に置換基としてフェニル低級アルキル基を有することのあるイミダゾリル低級アルキル基；フェノキシ低級アルキル基；フェニル低級アルコキシ置換低級アルキル基；2, 3-ジヒドロー1H-インデニル基又はイソインドリン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるイソインドリニル低級アルキル基を示す。】

化合物（1 g g）と化合物（23）との反応は、前記反応式-3における化合物（1 e）と化合物（7）との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0342】

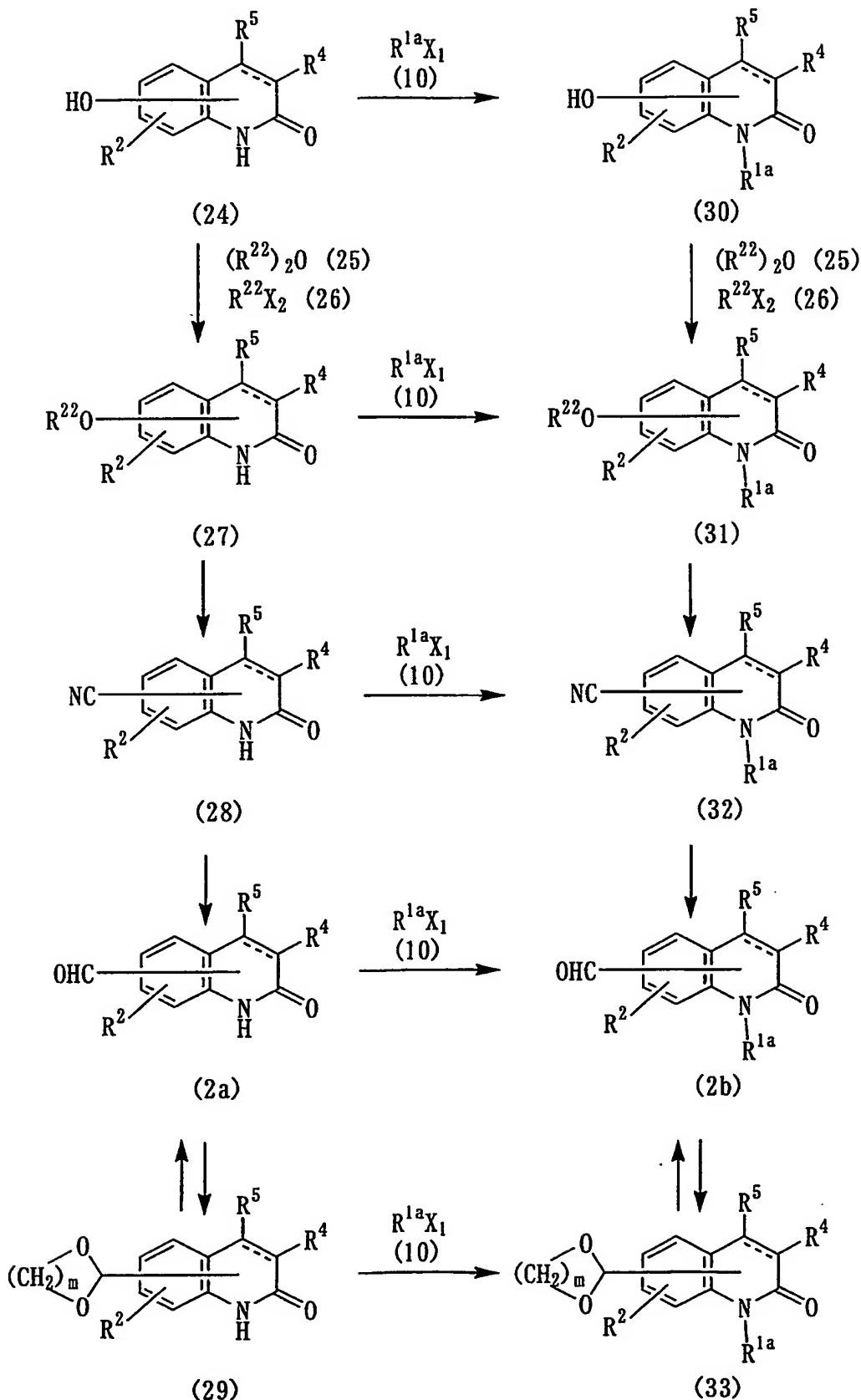
上記反応式において、出発原料として用いられる化合物（2）、化合物（4）及び化合物（8）は、例えば、下記反応式に示すようにして製造される。

【0343】

反応式-17

【0344】

【化20】



[0345]

[式中、 R^{1a} 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 X_1 及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同

出証特2005-3094054

じ。R²²は、ハロゲン原子を有することのある低級アルキルスルホニル基を示す。X₂は、ハロゲン原子を示す。mは1～4を示す。】

化合物(24)と化合物(25)又は(26)との反応及び化合物(30)と化合物(25)又は(26)との反応は、前記反応式-6における化合物(1j)と化合物(11)の反応で、(二)カルボン酸(1j)の酸ハロゲン化物、即ちカルボン酸ハライドにアミン(11)を反応させる方法と同様の反応条件下に行われる。

【0346】

化合物(27)を化合物(28)に導く反応及び化合物(31)を化合物(32)に導く反応は、適当な溶媒中、触媒の存在下、化合物(27)又は化合物(31)とシアノ金属と反応させることにより行われる。

【0347】

シアノ化金属としては、例えば、シアノ化ナトリウム、シアノ化カリウム、シアノ化銀、シアノ化亜鉛、シアノ化第一銅等を例示できる。

【0348】

この反応で使用される溶媒及び触媒としては、前記反応式-15における化合物(1d)と化合物(22)との反応で用いられる溶媒及び触媒をいずれも使用することができる。

【0349】

触媒は、化合物(27)又は化合物(31)に対して、通常0.01～等モル、好ましくは、0.01～0.5倍モル使用するのがよい。

【0350】

シアノ化金属は、化合物(27)又は化合物(31)に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～3倍モル使用するのがよい。

【0351】

該反応は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて行われ、一般に1時間～1週間程度にて終了する。

【0352】

化合物(28)を化合物(2a)に導く反応及び化合物(32)を化合物(2b)に導く反応は、適当な溶媒中、還元剤の存在下に行われる。

【0353】

ここで使用される溶媒としては、例えば、蟻酸等の脂肪酸、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類等又はこれらの混合溶媒を挙げることができる。

【0354】

還元剤としては、ジイソブチルアルミニウムハイドライド等のアルキルアルミニウムハイドライド類、ラネーニッケル等を例示できる。還元剤は、化合物(28)又は(32)に対して、通常少なくとも等重量、好ましくは等重量～5倍重量使用するのがよい。

【0355】

該反応は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて行われ、一般に0.5～20時間程度にて反応は終了する。

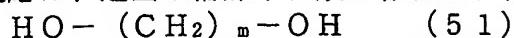
【0356】

化合物(2a)及び化合物(2b)は、前記反応式-1の化合物(1a)を化合物(1b)に導く反応において接触水素還元剤を使用する場合の反応条件と同様の反応条件下に、化合物(28)又は化合物(32)を還元することによっても製造される。該反応では、反応系内に塩酸、硫酸等の無機酸を、化合物(28)又は(32)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～2倍モル量添加するのがよい。

【0357】

化合物(2a)を化合物(29)に導く反応及び化合物(2b)を化合物(33)に導

く反応は、適当な溶媒中、酸の存在下、化合物(2a)又は化合物(2b)と一般式



[式中、mは前記に同じ。]で表されるアルコール化合物とを反応させることにより行われる。

【0358】

ここで使用される溶媒及び酸は、反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応で用いられる溶媒及び酸をいずれも使用することができる。

【0359】

酸は、通常触媒量使用するのがよい。化合物(51)の使用量は、化合物(2a)又は(2b)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。

【0360】

該反応は、室温～200°C、好ましくは室温～150°C付近にて行われ、一般に0.5～10時間程度にて反応は終了する。

【0361】

化合物(24)と化合物(10)との反応、化合物(27)と化合物(10)との反応、化合物(28)と化合物(10)との反応、化合物(2a)と化合物(10)との反応及び化合物(29)と化合物(10)との反応は、前記反応式-3における化合物(1e)と化合物(7)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0362】

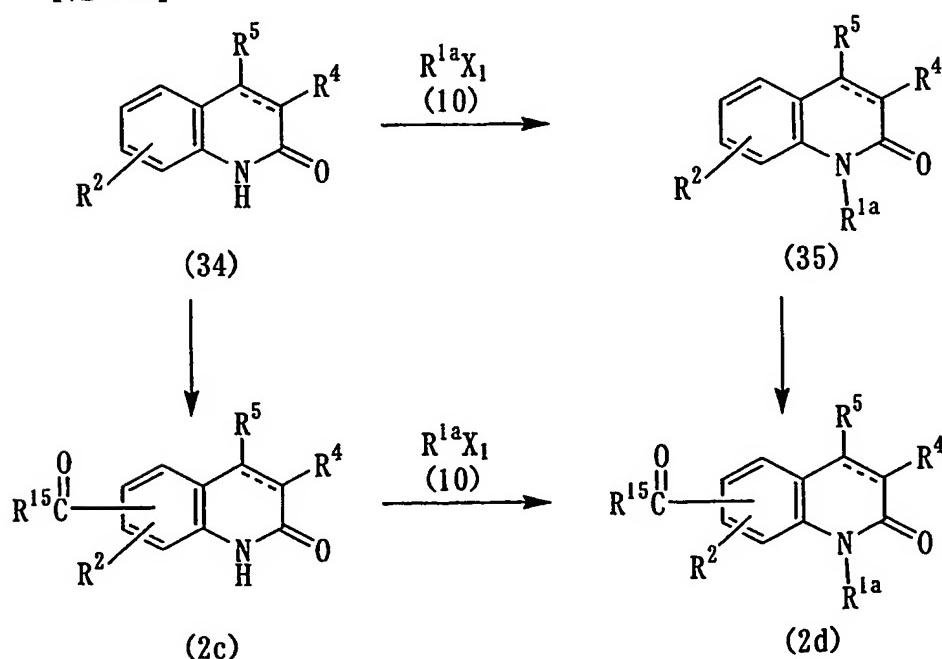
化合物(29)を化合物(2a)に導く反応及び化合物(33)を化合物(2b)に導く反応は、前記反応式-4の化合物(8)を化合物(9)に導く反応と同様の条件下に行われることができる。該反応では、酸としては、ピリジニウムp-トルエンスルホネート等のスルホネート類も使用することができる。

【0363】

反応式-18

【0364】

【化21】



【0365】

[式中、 R^{1a} 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^{15} 、 X_1 及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。]

化合物(34)をR¹⁵が水素原子を示す化合物(2c)に導く反応又は化合物(35)をR¹⁵が水素原子を示す化合物(2d)に導く反応は、適当な溶媒中、触媒の存在下、化合物(34)又は(35)と一般式



[式中、X₁及びX₂は前記と同じ。R²⁴は、低級アルキル基を示す。]で表される化合物と反応させることにより行われる。

【0366】

ここで使用される溶媒としては、前記反応式-15における化合物(1dd)と化合物(22)の反応で用いられる溶媒をいずれも使用することができる。

【0367】

触媒としては、例えば、四塩化チタン等のチタン化合物、塩化(IV)スズ等のスズ化合物、塩化アルミニウム等のアルミニウム化合物等を例示できる。触媒は、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。

【0368】

化合物(52)は、化合物(34)又は(35)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。

【0369】

該反応は、通常0～70℃、好ましくは0～50℃付近にて行われ、一般に1分～1時間程度で反応は終了する。

【0370】

化合物(34)をR¹⁵が水素原子を示す化合物(2c)に導く反応又は化合物(35)をR¹⁵が水素原子を示す化合物(2d)に導く反応は、ハロゲン化剤及び酸の存在下、化合物(34)又は(35)をパラホルムアルデヒドと反応させ、次いでヘキサメチルテトラミンを反応させることによっても行われる。

【0371】

ここで使用されるハロゲン化剤としては、例えば、塩酸、臭化水素酸等を挙げることができる。酸としては、例えば、硫酸、リン酸等の無機酸、p-トルエンスルホン酸、蟻酸、酢酸等の有機酸又はこれらの混合物を例示できる。ハロゲン化剤及び酸は、それぞれ通常大過剰使用するのがよい。

【0372】

パラホルムアルデヒドは、化合物(34)又は(35)に対して、通常少なくとも0.1倍重量、好ましくは0.1～等重量使用するのがよい。

【0373】

ヘキサメチルテトラミンは、化合物(34)又は(35)に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。

【0374】

該反応は、通常室温～150℃、好ましくは室温～100℃付近にて行われ、一般に0.5～10時間程度にて終了する。

【0375】

化合物(34)をR¹⁵が水素原子を示す化合物(2c)に導く反応又は化合物(35)をR¹⁵が水素原子を示す化合物(2d)に導く反応は、適当な溶媒中、酸の存在下、化合物(34)又は(35)をヘキサメチルテトラミンと反応させることによっても行うことができる。

【0376】

該反応は、一般に、ダッフ(Duff)反応と呼ばれている。ここで使用される酸としては、一般に、ダッフ反応で用いられる酸はいずれも使用可能であるが、例えば、酢酸、硼酸／無水グリセロール、トリフルオロ酢酸等が例示できる。酸は、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～大過剰量使用するのがよい。

【0377】

溶媒としては、前記反応式-15における化合物(1dd)と化合物(22)との反応

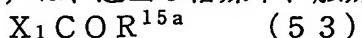
で用いられる溶媒をいずれも使用することができる。

【0378】

該反応は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて行われ、一般に0.5～10時間程度で終了する。

【0379】

R^{15} が低級アルキル基を示す化合物（2c）及び R^{15} が低級アルキル基を示す化合物（2d）は、適当な溶媒中、触媒の存在下、化合物（34）又は（35）と一般式



[式中、 X_1 は前記に同じ。 R^{15a} は低級アルキル基を示す。] で表される化合物と反応させることにより行われる。

【0380】

これらの反応は、一般にフリーデルークラフツ反応（Friedel-Crafts Reaction）と呼ばれ、適当な溶媒中ルイス酸の存在下に行われる。

【0381】

ここで使用されるルイス酸としては、一般にこの種フリーデルクラフツ反応で用いられるルイス酸をいずれも使用可能であるが、例えば、塩化アルミニウム、塩化亜鉛、塩化鉄、塩化スズ（IV）、三臭化硼素、三フッ化硼素、濃硫酸等を例示できる。

【0382】

使用される溶媒としては、例えば、二硫化炭素、ニトロベンゼン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素、テトラクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ニトロエタン、ニトロメタン等の脂肪族ニトロ化合物又はこれらの混合溶媒等を例示できる。

【0383】

ルイス酸は、化合物（34）又は（35）に対して、通常等モル～6倍モル量使用するのがよい。

【0384】

化合物（53）は、化合物（34）又は（35）に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。

【0385】

該反応は、通常、0～150℃、好ましくは0～100℃付近にて行われ、一般に0.5～2.5時間程度にて反応は終了する。

【0386】

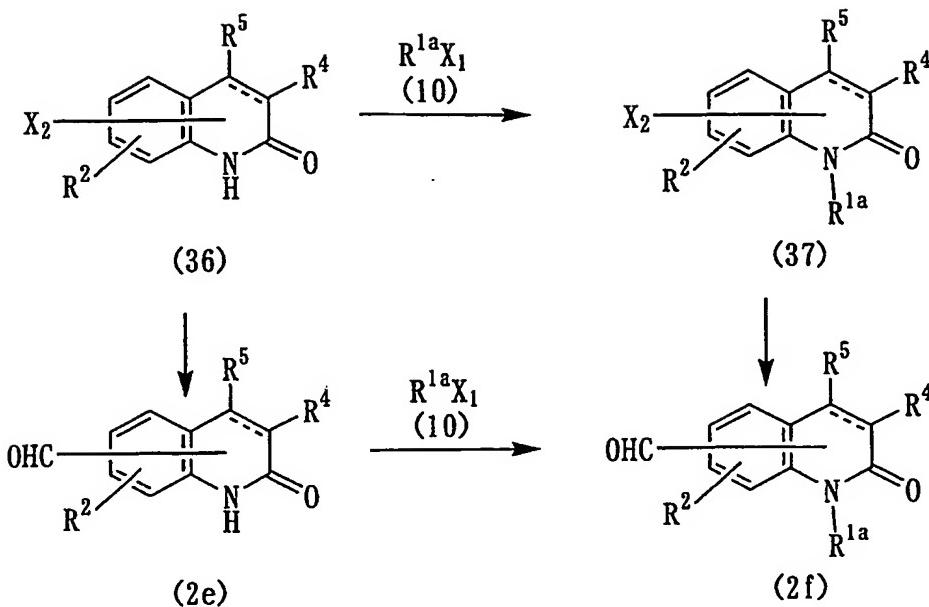
化合物（34）又は化合物（2c）と化合物（10）との反応は、前記反応式-3における化合物（1e）と化合物（7）との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0387】

反応式-19

【0388】

【化22】



【0389】

[式中、 R^{1a} 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 X_1 、 X_2 及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。]

化合物(36)を化合物(2e)に導く反応及び化合物(37)を化合物(2f)に導く反応は、適当な溶媒中、触媒及び酸アルカリ金属塩の存在下、化合物(36)又は(37)を一酸化炭素ガスと反応させることにより行われる。

【0390】

ここで使用される溶媒及び触媒としては、前記反応式-15における化合物(1dd)と化合物(22)との反応で用いられる溶媒及び触媒をいずれも使用することができる。

【0391】

酸アルカリ金属塩としては、例えば、蟻酸ナトリウム、蟻酸カリウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等を例示できる。酸アルカリ金属塩は、化合物(36)又は(37)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。

【0392】

触媒は、化合物(36)又は(37)に対して、通常0.01～等モル量使用するのがよい。

【0393】

一酸化炭素ガスは、化合物(36)又は(37)に対して、通常大過剰量使用するのがよい。

【0394】

該反応は、通常室温～200°C、好ましくは室温～150°C付近にて行われ、一般に0.5～10時間程度にて反応は終了する。

【0395】

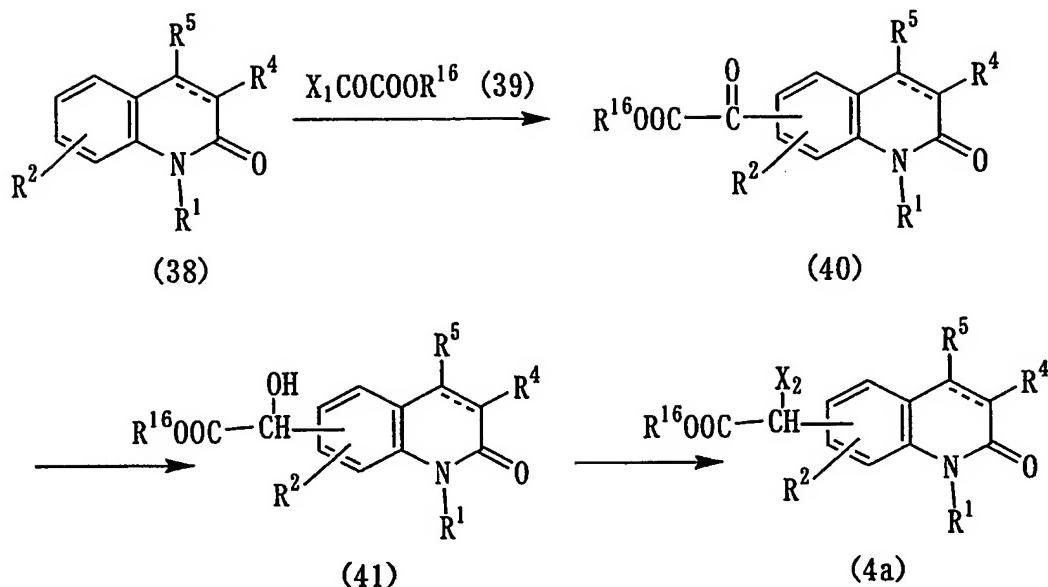
化合物(36)又は化合物(2e)と化合物(10)との反応は、前記反応式-3における化合物(1e)と化合物(7)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0396】

反応式-20

【0397】

【化 2 3】



[0398]

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 X_1 、 R^{16} 、 X_2 及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。]

化合物(38)と化合物(39)との反応は、前記反応式-18における化合物(34)と化合物(53)との反応と同様の反応条件下に行われる。

[0399]

化合物(40)を化合物(41)に導く反応は、前記反応式-1の化合物(1a)を化合物(1b)に導く反応において水素化還元剤を使用する場合の反応条件と同様の反応条件下に化合物(40)を還元することにより行われる。

[0400]

化合物(41)を化合物(4a)に導く反応は、適当な溶媒中又は無溶媒下、化合物(41)にハロゲン化剤と反応させることにより行われる。

[0401]

ハロゲン化剤としては、例えば、塩酸、臭化水素酸等の鉱酸、N,N-ジエチル-1,2,2-トリクロロビニルアジド、五塩化燐、五臭化燐、オキシ塩化燐、チオニルクロリド、スルホニルハライド化合物（メシリクロリド、トシリクロリド等）と塩基性化合物との混合物等を例示できる。

【0402】

塩基性化合物としては、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応で用いられる塩基性化合物をいずれも使用することができる。

[0403]

使用される溶媒としては、例えば、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル等のエーテル類、クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類等を例示できる。

[0404]

ハロゲン化剤としてスルホニルハライド化合物と塩基性化合物の混合物を用いる場合、スルホニルハライド化合物は、化合物(41)に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量使用するのがよい。塩基性化合物は、化合物(41)に対して、通常触媒量、好ましくは、触媒量～等モル使用するのがよい。その他のハロゲン化剤を用いる場合には、該ハロゲン化剤を、化合物(41)に対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～10倍モル量するのがよい。

[0405]

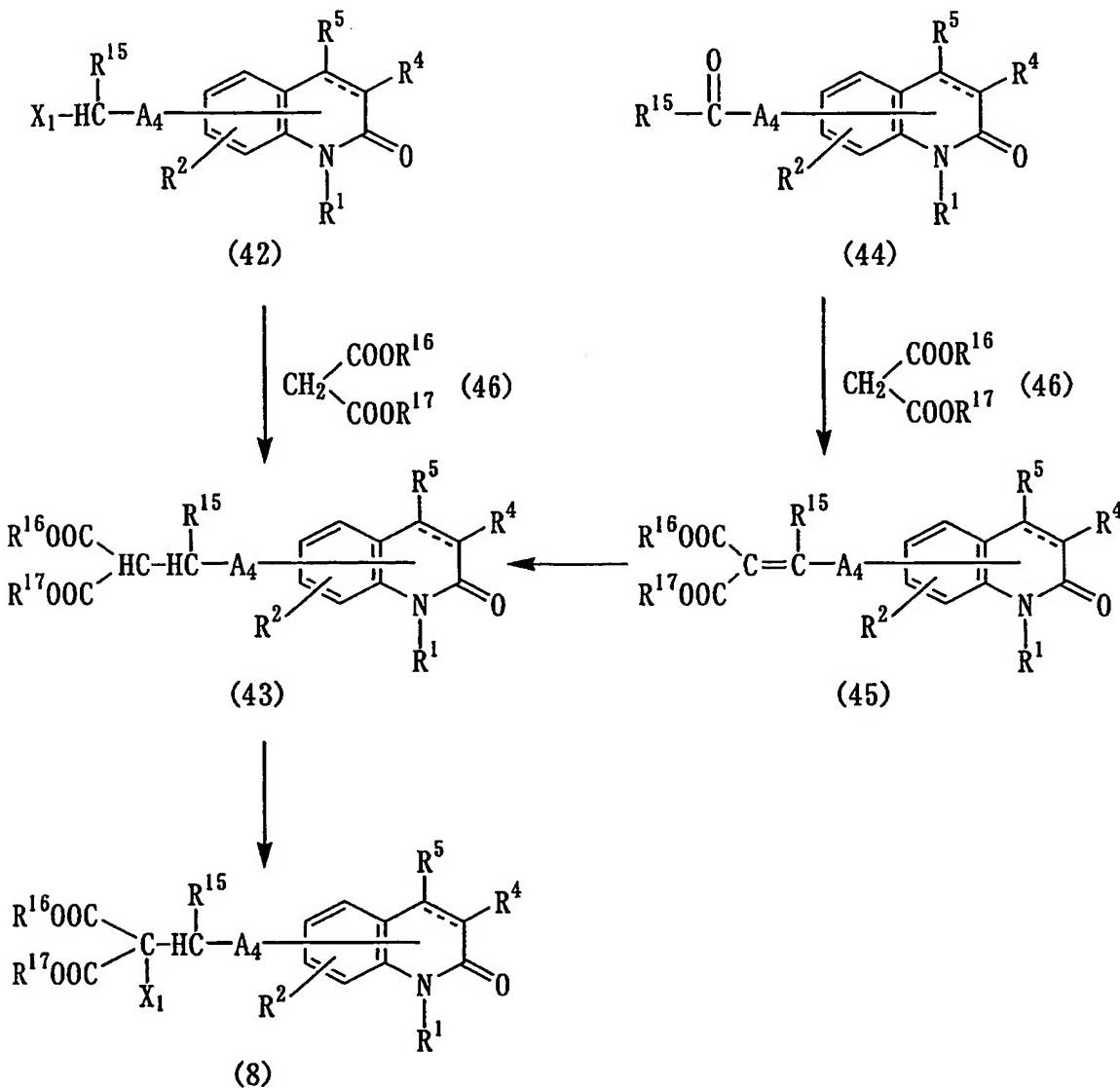
該反応は、通常室温～150℃、好ましくは室温～100℃にて好適に進行し、一般に1～10時間程度にて終了する。

【0406】

反応式-21

【0407】

【化24】



【0408】

[式中、R¹、R²、R⁴、R⁵、X₁、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、A₄及びカルボスチリル骨格の3, 4位の結合は前記に同じ。]

化合物(42)と化合物(46)との反応は、前記反応式-3における化合物(1e)と化合物(7)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0409】

化合物(43)を化合物(8)に導く反応は、適當な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下、ハロゲン化剤の存在下行われる。

【0410】

ここで使用されるハロゲン化剤としては、例えば、臭素、塩素等のハロゲン分子、塩化ヨウ素、スルフリルクロリド、臭化第一銅等の銅化合物、N-ブロモコハク酸イミド等のN-ハロゲン化コハク酸イミド等を例示できる。

【0411】

使用される溶媒としては、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、2-メトキシエタノール、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等とのハロゲン化炭化水素類、酢酸、プロピオン酸等の脂肪酸、二硫化炭素等を例示できる。

【0412】

塩基性化合物としては、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応で用いられる塩基性化合物をいずれも使用することができる。

【0413】

ハロゲン化剤は、化合物(43)に対して、通常等モル～10倍モル量、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。

【0414】

塩基性基化合物は、化合物(43)に対して、通常等モル～10倍モル量、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。

【0415】

該反応は、通常0～200℃、好ましくは0～100℃付近にて行われ、通常5分～20時間程度にて終了する。

【0416】

化合物(44)と化合物(46)との反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に行われる。

【0417】

ここで使用される塩基性化合物としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基性化合物、酢酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、ピペリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、DBN、DBU、DABCO等の有機塩基を例示できる。これらの塩基性化合物は、1種単独で又は2種以上混合して用いられる。

【0418】

不活性溶媒としては、反応に悪影響を及ぼさないものであればいずれでもよいが、例えば、水、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチル磷酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0419】

塩基性化合物は、化合物(45)に対して、通常0.1倍モル～5倍モル量程度用いられる。

【0420】

化合物(46)は、化合物(45)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量程度用いられる。

【0421】

反応温度は、通常室温～200℃、好ましくは50～150℃程度とするのがよく、一般に5分～30時間程度で反応は終了する。

【0422】

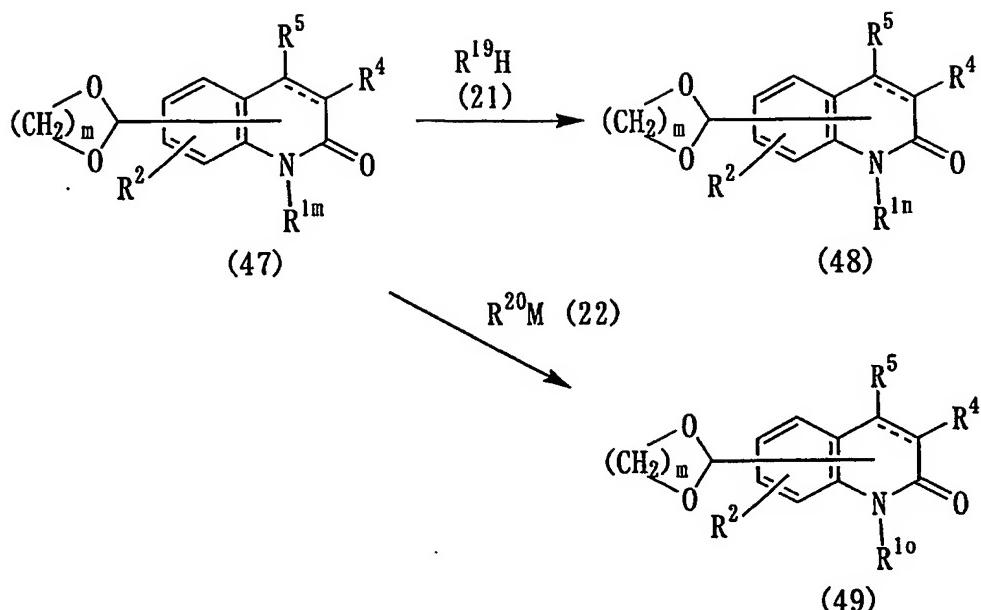
化合物(46)を化合物(43)に導く反応は、前記反応式-1の化合物(1a)を化合物(1b)に導く反応において接触水素還元剤を使用する場合の反応条件と同様の反応条件下に化合物(46)を還元することにより行われる。

[0 4 2 3]

反应式-22

[0424]

【化25】



【0 4 2 5】

[式中、 R^{1m} 、 R^{1n} 、 R^{1o} 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、M、m及びカルボスチリル骨格の3、4位の結合は前記に同じ。]

化合物(47)と化合物(21)との反応は、前記反応式-15における化合物(1d)と化合物(21)との反応と同様の反応条件下に行われる。

[0426]

化合物(47)と化合物(22)との反応は、前記反応式-15における化合物(1d)と化合物(22)との反応と同様の反応条件下に行われる。

104271

出発原料の化合物(24)、(34)、(36)、(38)、(42)及び(47)において、これらのR²が水酸基を示す化合物と化合物(23)とを反応させることにより、対応するR²が前記R²の(2-2)、(2-4)、(2-5)、(2-7)～(2-32)で定義されている基を示す化合物に導くことができる。この反応は、前記反応式-16における化合物(1g)と化合物(23)との反応と同様の反応条件下に行われる。

[04281]

出発原料の化合物(38)及び(42)において、これらのR¹が水素原子を示す化合物と化合物(10)とを反応させることにより、対応するR¹が前記R¹の(1-2)～(1-17)で定義されている基を示す化合物に導くことができる。この反応は、前記反応式-5における化合物(1h)と化合物(10)との反応と同様の反応条件下に行われる。

[0429]

上記に示す各反応式で得られる各々の目的化合物は、反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、反応混合物から単離精製することができる。

[0430]

本発明の一般式(1)で表される化合物は、立体異性体及び光学異性体を包含する。

[0431]

本発明化合物のうち塩基性基を有する化合物は、通常の薬理的に許容される酸と容易に

塩を形成し得る。このような酸としては、例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩、メタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、酢酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、リンゴ酸塩、乳酸塩等の有機酸塩等が挙げられる。

【0432】

また本発明化合物のうち酸性基を有する化合物は、医薬的に許容される塩基性化合物を作用させることにより容易に塩を形成させることができる。このような塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を挙げることができる。

【0433】

次に、本発明化合物を有効成分として含有する医療製剤について説明する。

【0434】

上記医療製剤は、本発明化合物を通常の医療製剤の形態に製剤したものであって、通常使用される充填剤、增量剤、結合剤、付湿剤、崩壊剤、表面活性剤、滑沢剤等の希釈剤あるいは賦形剤を用いて調製される。

【0435】

このような医療製剤としては、治療目的に応じて種々の形態の中から選択でき、その代表的なものとして錠剤、丸剤、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプセル剤、坐剤、注射剤（液剤、懸濁剤等）等が挙げられる。

【0436】

錠剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、乳糖、白糖、塩化ナトリウム、ブドウ糖、尿素、デンプン、炭酸カルシウム、カオリン、結晶セルロース等の賦形剤、水、エタノール、プロパンノール、単シロップ、ブドウ糖液、デンプン液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピロリドン等の結合剤、乾燥デンプン、アルギン酸ナトリウム、寒天末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、デンプン、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加油等の崩壊抑制剤、第4級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、デンプン等の保湿剤、デンプン、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、ホウ酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等が挙げられる。

【0437】

更に、錠剤は、必要に応じて通常の錠皮を施した錠剤、例えば、糖衣剤、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とすることができる。

【0438】

丸剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ブドウ糖、乳糖、デンプン、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナラン、寒天等の崩壊剤等が挙げられる。

【0439】

坐剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類、ゼラチン、半合成グリセライド等が挙げられる。

【0440】

注射剤として調製される場合は、液剤、乳剤及び懸濁剤は殺菌され、かつ血液と等張であるのが好ましい。これらの液剤、乳剤及び懸濁剤の形態に成形する際に用いられる希釈剤としては、公知のものを広く用いられているものを使用することができ、例えば、水、エタノール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチレンソルベタン脂肪酸エステル類等が挙げ

られる。なお、この場合、等張性の溶液を調製するのに十分な量の食塩、ブドウ糖あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有させてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を、更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を含有させてもよい。

【0441】

医療製剤中に含有される本発明化合物の量は、特に限定されず広い範囲内から適宜選択することができるが、通常、医療製剤中に本発明化合物を1～70重量%含有させるのが好ましい。

【0442】

本発明に係る医療製剤の投与方法としては特に制限はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別、疾患の状態、その他の条件に応じた方法で投与される。例えば、錠剤、丸剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤及びカプセル剤の場合には経口投与される。また、注射剤の場合には、単独であるいはブドウ糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内に投与したり、更には必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮下もしくは腹腔内に投与することができる。坐剤の場合には、直腸内に投与される。

【0443】

上記医療製剤の投与量は、用法、患者の年齢、性別、疾患の程度、その他の条件に応じて適宜選択すればよく、通常、1日あたり体重1kgに対して0.001～100mg、好ましくは0.001～50mgを1回～数回に分けて投与される。

【0444】

上記投与量は、種々の条件で変動するので、上記範囲より少ない投与量で充分な場合もあるし、また上記範囲を超えた投与量が必要な場合もある。

【発明の効果】

【0445】

本発明のカルボスチリル誘導体は、TFF2を選択的に產生誘導するので、TFF2誘導剤(up-regulator)の有効成分として有用である。

【0446】

本発明化合物は、そのTFF2產生誘導作用に基づいて、ヒト及び獣医学において、各種疾病的予防又は治療剤、例えば潰瘍性疾患の予防及び治療剤として使用できる。具体的には、TFF2產生誘導作用に基づいて予防又は治療効果が得られる疾患として、様々な起源発生の急性及び慢性消化管疾患（例えば、薬剤性潰瘍、消化性胃潰瘍、潰瘍性大腸炎、クローン病、薬剤性腸炎、虚血性大腸炎、過敏性腸症候群、内視鏡的粘膜切除術後潰瘍、急性胃炎、慢性胃炎、逆流性食道炎・食道潰瘍、Barrett食道、化学療法及び放射線療法時の消化管粘膜炎、痔疾患等）、口腔疾患（例えば、化学療法及び放射線療法時の口内炎、アフタ性口内炎、シェーグレン症候群、口腔乾燥症等）、上気道疾患（例えば、鼻炎、咽頭炎等）、気道疾患（例えば、気管支喘息、慢性閉塞性肺疾患等）、眼疾患（例えば、ドライアイ、角結膜炎等）、癌及び創傷等を例示できる。

【0447】

本発明の化合物は、副作用が少なく、安全性に優れている。

【発明を実施するための最良の形態】

【0448】

以下に実施例を掲げて、本発明をより一層明らかにする。

【0449】

参考例1

8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

8-メトキシ-1-メチル-1H-キノリン-2-オン21.14g(0.11モル)、パラホルムアルデヒド10.6gを濃塩酸105mlに懸濁し、濃硫酸4mlを加えて70～80℃で2.5時間攪拌した。室温まで冷却し、反応液に氷水を加えてジクロロメタンで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に

溶媒を留去した。残渣をクロロホルム400m1に溶解し、ヘキサメチレンテトラミン4.25g(0.03モル)を加えて2.5時間加熱還流した。室温まで冷却し、減圧下に溶媒を留去した。残渣に50%酢酸110m1を加えて100℃で2時間攪拌した。室温まで冷却し、水を加えて不溶物を濾取乾燥して、淡黄色粉末の8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを13.81g(収率57%)得た。

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ ppm:

3.80(3H, s), 4.01(3H, s), 6.79(1H, d, J=9.9Hz), 7.45(1H, d, J=8.4Hz), 7.86(1H, d, J=8.4Hz), 9.05(1H, d, J=9.9Hz), 10.14(1H, s)。

【0450】

参考例2

2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イルメチレン)マロン酸ジエチルの合成

ピリジン90m1に8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド18.9g、マロン酸ジエチル26.5m1及びピペリジン2.7m1を加え、90-100℃で6時間攪拌した。室温まで冷却し、反応液を冷濃塩酸に加えて析出した固体を濾取し、水洗し、乾燥して、黄色粉末の2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イルメチレン)マロン酸ジエチルを16.62g(収率53%)得た。

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ ppm:

1.10(3H, t, J=7.2Hz), 1.28(3H, t, J=7.2Hz), 3.80(3H, s), 3.92(3H, s), 4.05-4.3(4H, m), 6.69(1H, d, J=9.8Hz), 7.18(1H, d, J=8.5Hz), 7.30(1H, d, J=8.5Hz), 7.84(1H, d, J=9.8Hz), 8.14(1H, s)。

【0451】

参考例3

2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イルメチレン)マロン酸ジエチルの合成

エタノール300m1に2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イルメチレン)マロン酸ジエチル16.62g及び10%パラジウム炭素1.6gを加え、室温、常圧で6時間接触還元した。触媒を濾過して除き、濾液を減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:1)で精製し、淡黄色油状物の2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イルメチレン)マロン酸ジエチルを13.59g(収率81%)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

1.15-1.3(6H, m), 3.45(2H, d, J=7.6Hz), 3.60(1H, t, J=7.6Hz), 3.89(3H, s), 3.95(3H, s), 4.1-4.25(4H, m), 6.75(1H, d, J=9.8Hz), 6.96(1H, d, J=8.3Hz), 7.04(1H, d, J=8.3Hz), 7.86(1H, d, J=9.8Hz)。

【0452】

参考例4

2-クロロ-2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イルメチレン)マロン酸ジエチルの合成

2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イルメチレン)マロン酸ジエチル13.59gのテトラヒドロフラン(THF)溶液(140m1)に氷冷下、水素化ナトリウム(60%油性)1.0gを加えて水素の発生が止まるま

で攪拌した。これにN-クロロスクシンイミド5.6 gを加えて1時間攪拌した。反応液を冷塩酸に加えてジクロロメタンで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮し、残渣にジイソプロピルエーテルを加えて析出した固体を濾取乾燥して、淡黄色粉末の2-クロロ-2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イルメチル)マロン酸ジエチルを12.77 g(収率86%)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

1.28(3H, t, J=7.2Hz), 3.86(2H, s), 3.89(3H, s), 3.92(3H, s), 4.2-4.3(4H, m), 6.71(1H, d, J=9.8Hz), 6.98(1H, d, J=8.4Hz), 7.10(1H, d, J=8.4Hz), 7.93(1H, d, J=9.8Hz)。

【0453】

参考例5

2-クロロ-2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)プロピオン酸の合成

2-クロロ-2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イルメチル)マロン酸ジエチル5.1gを酢酸20m1及び6N-塩酸15m1の混合液に加えて9時間加熱還流した。室温まで冷却後、反応液に水を加えて氷冷し、析出した固体を濾取し、水洗し、乾燥して、淡黄色粉末の2-クロロ-2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)プロピオン酸を3.1g得た。

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ ppm:

3.45-3.65(2H, m), 3.77(3H, s), 3.86(3H, s), 4.5-4.65(1H, m), 6.62(1H, d, J=9.8Hz), 7.14(1H, d, J=8.3Hz), 7.21(1H, d, J=8.3Hz), 8.03(1H, d, J=9.8Hz), 13.4(1H, brs)。

【0454】

参考例6

2-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)エチル]マロン酸ジエチルの合成

マロン酸ジエチル2.2m1のTHF溶液(30m1)に氷冷下、水素化ナトリウム(60%油性)0.5gを加えて水素の発生が止まるまで攪拌した。これに5-(2-ヨードエチル)-8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン1.54gを加えて室温で一夜攪拌した。反応液を冷塩酸に加えてジクロロメタンで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(ジクロロメタン:メタノール=50:1→40:1)で精製した。減圧下に濃縮して、黄色油状の2-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)エチル]マロン酸ジエチルを1.73g(収率定量的)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

1.2-1.4(6H, m), 2.1-2.25(2H, m), 2.8-3.0(2H, m), 3.3-3.5(1H, m), 3.88(3H, s), 3.93(3H, s), 4.1-4.4(4H, m), 6.75(1H, d, J=9.7Hz), 6.9-7.1(2H, m), 7.92(1H, d, J=9.7Hz)。

【0455】

参考例7

2-クロロ-2-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)エチル]マロン酸ジエチルの合成

2-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)エチル]マロン酸ジエチル1.79gのTHF溶液(30m1)に氷冷下、水素化ナトリウム(60%油性)0.21gを加えて水素の発生が止まるまで攪拌した。これにN-クロロスクシンイミド0.7gを加えて1.5時間攪拌した。反応液を冷塩酸に加

えてジクロロメタンで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後減圧下に濃縮し、黄色油状の2-クロロ-2-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)エチル]マロン酸ジエチルを2.38g(収率定量的)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

1.31(6H, t, J=7.1Hz), 2.47(2H, t, J=8.7Hz), 2.98(2H, t, J=8.7Hz), 3.88(3H, s), 3.93(3H, s), 6.75(1H, d, J=9.7Hz), 6.9-7.1(2H, m), 7.87(1H, d, J=9.7Hz)。

【0456】

参考例8

2-クロロ-2-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)酪酸の合成

2-クロロ-2-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)エチル]マロン酸ジエチル2.38gを、酢酸10ml及び6N-塩酸15mlの混合液に加えて一夜加熱還流した。室温まで冷却後、反応液に水及び少量のエタノールを加えて氷冷し、析出した固体を濾取し、水洗し、乾燥して、灰色粉末の2-クロロ-2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)酪酸を0.99g(収率55%)得た。

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ ppm:

1.9-2.3(2H, m), 2.8-3.1(2H, m), 3.77(3H, s), 3.85(3H, s), 4.4-4.6(1H, m), 6.61(1H, d, J=9.7Hz), 7.05(1H, d, J=7.1Hz), 7.18(1H, d, J=7.1Hz), 7.98(1H, d, J=9.7Hz), 13.4(1H, brs)。

【0457】

参考例9

2-[3-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)プロピル]マロン酸ジエチルの合成

マロン酸ジエチル1.85mlのTHF溶液(30ml)に氷冷下水素化ナトリウム(60%油性)0.39gを加えて水素の発生が止まるまで攪拌した。これに5-(2-ヨードプロピル)-8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン2.89gを加え、室温で4.5時間攪拌した。反応液を冷塩酸に加え、ジクロロメタンで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(ジクロロメタン:メタノール=20:1)で精製した。得られる精製物を減圧下に濃縮して、黄色油状の2-[3-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)プロピル]マロン酸ジエチルを2.94g(収率93%)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

1.27(6H, t, J=7.1Hz), 1.6-1.8(2H, m), 1.95-2.1(2H, m), 2.87(2H, t, J=7.7Hz), 3.56(1H, t, J=7.5Hz), 3.89(3H, s), 3.95(3H, s), 4.1-4.4(4H, m), 6.73(1H, d, J=9.8Hz), 7.00(2H, s), 7.84(1H, d, J=9.8Hz)。

【0458】

参考例10

2-クロロ-2-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)プロピル]マロン酸ジエチルの合成

2-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)プロピル]マロン酸ジエチル2.94gのTHF溶液(30ml)に氷冷下、水素化ナトリウム(60%油性)0.33gを加えて水素の発生が止まるまで攪拌した。これにN-クロロスクシンイミド1.2gを加えて2時間攪拌した。反応液を冷塩酸に加え

、ジクロロメタンで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮し、黄色油状の2-クロロ-2-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)プロピル]マロン酸ジエチルを4.02g(収率定量的)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

1.26(6H, t, J=7.1Hz), 1.6-1.9(2H, m), 2.31(2H, t, J=8.0Hz), 2.88(2H, t, J=7.7Hz), 3.88(3H, s), 3.94(3H, s), 6.72(1H, d, J=9.8Hz), 6.99(2H, s), 7.79(1H, d, J=9.8Hz)。

【0459】

参考例11

2-クロロ-2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)吉草酸の合成

2-クロロ-2-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)プロピル]マロン酸ジエチル4.02gを、酢酸15ml及び6N-塩酸20mlの混合液に加えて24時間加熱還流した。室温まで冷却後、反応液に水を加えて氷冷し、析出した固体を濾取し、水洗し、乾燥して、淡黄色粉末の2-クロロ-2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)吉草酸を2.30g(収率75%)得た。

¹H-NMR(DMSO-d) δ ppm:

1.6-2.2(4H, m), 2.7-3.1(2H, m), 3.77(3H, s), 3.84(3H, s), 4.5-4.65(1H, m), 6.59(1H, d, J=9.7Hz), 7.05(1H, d, J=8.1Hz), 7.17(1H, d, J=8.1Hz), 7.99(1H, d, J=9.7Hz), 13.2(1H, brs)。

【0460】

参考例12

8-メトキシ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

8-メトキシ-3,4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン5gをジクロロメタン100mlに溶解し、室温でジクロロメチルメチルエーテル6.4mlを加え、氷水浴で冷却した。10℃以下で四塩化チタン85mlを滴下した。室温で終夜攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、水層をジクロロメタンで抽出し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後減圧濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加えて生じた固体を濾取し、乾燥して、8-メトキシ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド5.2g(収率90%)を得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

2.63(2H, t, J=7.4Hz), 3.54(2H, t, J=7.4Hz), 3.97(3H, s), 6.92(1H, d, J=8.5Hz), 7.50(1H, d, J=8.5Hz), 7.84(1H, brs), 10.02(1H, s)。

【0461】

参考例13

8-メトキシ-1-エチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

8-メトキシ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド2.0gをDMF20mlに溶かし、氷冷下水素化ナトリウム(60%油性)0.43gを加えた。添加後、水素の発生が終わるまで室温で攪拌した。再び氷水浴で冷却してヨウ化エチル1.2mlを滴下し、室温で8時間攪拌した。反応液を氷塩酸水に注ぎ、メチレンクロリドで抽出し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトで精製し、8-メトキシ-1-エチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド2.1g(収率91%)を得た。

¹H-NMR (CDC13) δ ppm:

1. 15 (3H, t, J=7. 1Hz), 2. 51 (2H, t, J=7. 0Hz), 3. 36 (2H, t, J=7. 0Hz), 3. 97 (3H, s), 4. 01 (2H, t, J=7. 4Hz), 6. 98 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 60 (1H, d, J=8. 6Hz), 10. 06 (1H, s)。

【0462】

参考例14

8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

8-メトキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン1.5gをDMF150mLに溶かし、氷冷下水素化ナトリウム(60%油性)3.6gを加えた。添加後、水素の発生が止まるまで室温で攪拌した。再び氷水で冷却してヨウ化メチル5.8mLを滴下し、室温で終夜攪拌した。溶媒を減圧濃縮してできた残渣をシリカゲルカラムクロマトで精製し、8-メトキシ-1-メチル-2-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを16.7g(収率96%)得た。

¹H-NMR (CDC13) δ ppm:

2. 5-2. 6 (2H, m), 2. 8-2. 9 (2H, m), 3. 39 (3H, s), 3. 85 (3H, s), 6. 75-6. 9 (2H, m), 7. 0-7. 05 (1H, m)。

【0463】

参考例15

8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン1.5gをジクロロメタン15mLに溶かし、室温でジクロロメチルメチルエーテル0.86mL加え、氷水で冷却した。四塩化チタン10.5mLを滴下した後、室温で終夜攪拌した。更にジクロロメチルメチルエーテル1.29mL及び四塩化チタン15.8mL加え、室温で5時間攪拌した。その後氷水に内容物をあけ、水層をジクロロメタンで抽出し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後減圧濃縮した。残渣にヘキサンを加え、生成した不溶物を濾取し、乾燥し、8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを1.37g得た(収率80%)。

¹H-NMR (CDC13) δ ppm:

2. 5-2. 55 (2H, m), 3. 3-3. 45 (2H, m), 3. 96 (3H, s), 6. 99 (1H, d, J=8. 6Hz), 7. 60 (1H, d, J=8. 6Hz), 10. 06 (1H, s)。

【0464】

参考例16

1-(4-ビフェニルメチル)-6-プロモ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

6-プロモ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン2.54gのDMF溶液(20mL)に、0℃で水素化ナトリウム(60%油性)0.49gを加えて30分攪拌した。これに4-プロモメチルビフェニル3.05gを加えて室温で一夜攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:6→1:2)で精製した。クロロホルム-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の1-(4-ビフェニルメチル)-6-プロモ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを4.06g(収率92%)得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 65-2. 78 (2H, m), 2. 89-3. 03 (2H, m), 5. 17 (2H, s), 6. 90 (1H, d, J=8. 7Hz), 7. 23-7. 39 (4H, m), 7. 39-7. 50 (3H, m), 7. 50-7. 71 (4H, m)。

【0465】

参考例 17

1-(4-ビフェニルメチル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-6-カルボキサルデヒドの合成

1-(4-ビフェニルメチル)-6-プロモ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン 2.80 g、蟻酸ナトリウム 0.171 g 及びビストリフェニルホスフィン塩化パラジウム 0.25 g の DMF 溶液 (30 ml) を一酸化炭素雰囲気下 100°C で 4 時間攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 4 → 1 : 2) で精製した。クロロホルム-ジエチルエーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の 1-(4-ビフェニルメチル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-6-カルボキサルデヒドを 1.95 g (収率 78%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2.78 (2H, t, J = 8.0 Hz), 3.07 (2H, t, J = 8.0 Hz), 5.24 (2H, s), 7.15 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.25-7.49 (5H, m), 7.55-7.82 (6H, m), 9.84 (1H, s)。

【0466】

参考例 18

1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-4-カルボキサルデヒドの合成

2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-4-カルボキサルデヒド 5.13 g の DMF 溶液 (50 ml) に、0°C で水素化ナトリウム (60% 油性) 1.3 g を加えて 30 分攪拌した。これに 4-クロロベンジルブロミド 7.0 g を加えて室温で一夜攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 10 → 1 : 4) で精製した。クロロホルム-ジイソプロピルエーテル-n-ヘキサン混合溶媒から再結晶して、白色粉末の 1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-4-カルボキサルデヒドを 4.13 g (収率 47%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

5.55 (2H, s), 7.24 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.28-7.39 (4H, m), 7.45 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.50-7.64 (1H, m), 8.68 (1H, dd, J = 1.3, 8.1 Hz), 10.24 (1H, s)。

【0467】

参考例 19

1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボキサルデヒドの合成

2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボキサルデヒド 5.13 g の DMF 溶液 (50 ml) に、0°C で水素化ナトリウム (60% 油性) 1.3 g を加えて 30 分攪拌した。これに 4-クロロベンジルブロミド 7.0 g を加えて室温で一夜攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 10 → 1 : 4) で精製した。クロロホルム-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の 1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボキサルデヒドを 6.57 g (収率 72%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

5.56 (2H, s), 7.21-7.39 (5H, m), 7.44 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.61-7.72 (1H, m), 8.02 (1H, dd, J = 1.4, 7.8 Hz), 8.59 (1H, s), 10.31 (1H, s)。

【0468】

参考例 20

5-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オ

ンの合成

5-ヒドロキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン 15. 9 g の無水ジクロロメタン溶液 (200 ml) に、0°C攪拌下ピリジン30 ml 及びトリフルオロメタンスルホン酸無水物 25 g を加えて2時間攪拌した。減圧下に濃縮し、残渣に水を加えてジクロロメタンで抽出した。水、硫酸水素カリウム水溶液、水の順で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して、淡褐色粉末の5-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを28 g (収率97%) 得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 67 (2H, dd, J=6. 3 Hz, J=8. 8 Hz), 3. 07 (2H, t, J=7. 2 Hz), 6. 80-6. 90 (1H, m), 6. 90-7. 02 (1H, m), 7. 16-7. 32 (1H, m), 8. 95 (1H, brs)。

【0469】

参考例21

5-シアノ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

5-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン 1. 5 g、青酸亜鉛 1. 3 g 及びテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム 0. 59 g をDMF 20 ml に懸濁し、100°Cで2時間攪拌した。不溶物を濾過して除き、濾液に酢酸エチルを加えて水洗した。無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮後、残渣を酢酸エチル-ジエチルエーテル混合溶媒から再結晶して、淡褐色粉末の5-シアノ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを0. 71 g (収率81%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 45-2. 60 (2H, m), 3. 05 (2H, t, J=7. 2 Hz), 7. 08-7. 18 (1H, m), 7. 28-7. 40 (2H, m), 10. 37 (1H, brs)

。

【0470】

参考例22

2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

5-シアノ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン 100 mg 及びラネニッケル 100 mg を蟻酸 10 ml に懸濁し、2時間加熱還流した。ラネニッケル 100 mg を追加して1時間加熱還流した。反応液を濾過して不溶物を除き、濾液を濃縮した。残渣に酢酸エチル及び水を加えて攪拌後、セライト濾過した。濾液を分液し、有機層を水洗した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル-n-ヘキサン混合溶媒から再結晶して、淡褐色粉末の2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを77 mg (収率76%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 39-2. 51 (2H, m), 3. 35 (2H, t, J=7. 4 Hz), 7. 10-7. 17 (1H, m), 7. 31-7. 41 (1H, m), 7. 44-7. 50 (1H, m), 10. 18 (1H, s), 10. 26 (1H, brs)。

【0471】

参考例23

1-(4-ビフェニルメチル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド 1. 0 g のDMF溶液 (10 ml) に、0°Cで水素化ナトリウム (60%油性) 0. 25 g を加えて30分攪拌した。これに4-プロモメチルビフェニル 1. 69 g を加えて室温で1時間攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (酢酸エチル:n-ヘキサン = 1:4 → 1:2) で精製した。クロロホルム-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して、無色板状晶の1-(4-ビフェニルメチル)-2-オキソ-1

, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを 1. 11 g (収率 56 %) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 65 - 2. 78 (2H, m), 3. 45 (2H, t, J = 7. 6 Hz), 5. 24 (2H, s), 7. 21 - 7. 49 (7H, m), 7. 49 - 7. 57 (1H, m), 7. 57 - 7. 70 (4H, m), 10. 24 (1H, s)。

【0472】

参考例24

5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを 4.2 g をトルエン 400 ml に懸濁し、エチレングリコール 33. 7 ml 及び p-トルエンスルホン酸 1 水和物 0. 78 g を加え、ディーン-スタークで 4 時間半加熱還流した。反応液を冷却させ重曹 1. 72 g を含む水溶液 10 ml を加え、しばらく攪拌し、生じた固体を濾別した。水、トルエンで洗浄後、60℃で乾燥し、5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを 35. 5 g 白色結晶として得た (収率 70 %)。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 33 - 2. 44 (2H, m), 2. 85 - 2. 98 (2H, m), 3. 79 (3H, s), 3. 86 - 4. 08 (4H, m), 5. 78 (1H, s), 6. 86 (1H, d, J = 8. 5 Hz), 7. 07 (1H, d, J = 8. 5 Hz), 8. 97 (1H, s)。

【0473】

参考例25

1-(6-クロロピリジン-3-イルメチル)-5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン 1.0 g の DMF 溶液 (70 ml) に、氷冷下水素化ナトリウム (55 %油性) 2. 1 g を少量ずつ加え水素の発生が止まるまで室温で攪拌した。再度氷冷し、これに 2-クロロ-5-クロロメチルピリジン 9. 74 g の DMF 溶液 (30 ml) を滴下して加えた。室温で 4 時間攪拌し、反応液を氷水に注ぎ、生成した不溶物を濾取し、濾液を水及びジエチルエーテルで洗浄後、乾燥して、淡黄色固体の 1-(6-クロロピリジン-3-イルメチル)-5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを 11. 84 g (収率 79 %) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 47 - 2. 53 (2H, m), 2. 88 - 2. 94 (2H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 91 - 4. 04 (4H, m), 5. 08 (2H, s), 5. 80 (1H, s), 6. 88 (1H, d, J = 8. 6 Hz), 7. 19 (1H, d, J = 8. 6 Hz), 7. 38 (1H, d, J = 8. 3 Hz), 7. 60 (1H, dd, J₁ = 2. 3 Hz, J₂ = 8. 3 Hz), 8. 19 (1H, d, J = 2. 3 Hz)。

【0474】

参考例26

5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-1-[6-(N-メチル-N-フェニルアミノ)ピリジン-3-イルメチル]-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

1-(6-クロロピリジン-3-イルメチル)-5-[1, 3]ジオキソラン-2-イル-8-メトキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン 0. 4 g、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム 48. 8 mg、4, 5-ビス(ジフェニルホスフィノ)-9, 9-ジメチルキサンテン 92. 6 mg 及びナトリウム tert-ブトキシド 0. 15 g をトルエン 10. 6 ml に懸濁し、N-メチルアミニン 0. 17 g を加え、アルゴン雰囲気下 13 時間加熱還流した。減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト

(酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1→ジクロロメタン：メタノール=20：1)で精製した。減圧下に濃縮し、無定形固体の5-(1,3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-1-[6-(N-メチル-N-フェニルアミノ)ピリジン-3-イルメチル]-3,4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを0.45g(収率95%)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

2.52-2.58(2H, m), 2.74-2.80(2H, m), 3.40(3H, s), 3.83(3H, s), 3.98-4.12(4H, m), 5.22(2H, s), 5.81(1H, s), 6.39(1H, d, J=8.7Hz), 6.76(1H, d, J=8.7Hz), 7.13-7.26(4H, m), 7.33-7.39(3H, m), 7.99(1H, d, J=2.0Hz)。

【0475】

参考例27

8-メトキシ-1-[6-(N-メチル-N-フェニルアミノ)ピリジン-3-イルメチル]-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

5-(1,3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-1-[6-(N-メチル-N-フェニルアミノ)ピリジン-3-イルメチル]-3,4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン0.95gのアセトン(19m1)及び水(9.5m1)混合溶液に、ピリジニウムパラトルエンスルホナート(PPTS)0.54gを加えて2時間加熱還流した。反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて酢酸エチルで抽出し、水で2回洗浄し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト(酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1)で精製した。減圧下に濃縮し、淡黄色無定形固体の8-メトキシ-1-[6-(N-メチル-N-フェニルアミノ)ピリジン-3-イルメチル]-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを0.69g(収率81%)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

2.53-2.59(2H, m), 3.28-3.34(2H, m), 3.39(3H, s), 3.95(3H, s), 5.23(2H, s), 6.37(1H, d, J=8.8Hz), 6.90(1H, d, J=8.6Hz), 7.09(1H, dd, J₁=2.4Hz, J₂=8.8Hz), 7.16-7.21(3H, m), 7.33-7.39(2H, m), 7.54(1H, d, J=8.6Hz), 7.94(1H, d, J=2.4Hz), 10.00(1H, s)。

【0476】

参考例28

5-(1,3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-1-(6-チオフェン-3-イルピリジン-3-イルメチル)-3,4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

1-(6-クロロピリジン-3-イルメチル)-5-(1,3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-3,4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン0.4g、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム0.12g及び2N-炭酸ナトリウム水溶液2.5m1を1,2-ジメトキエタン8m1に懸濁し、3-チオフェンボロン酸0.20gを加えアルゴン雰囲気下4時間加熱還流した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、水で2回洗浄し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト(酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1)で精製した。減圧下に濃縮し、淡褐色無定形固体の5-(1,3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-1-(6-チオフェン-3-イルピリジン-3-イルメチル)-3,4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを0.45g(収率95%)得た。

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ ppm:

2.49-2.51(2H, m), 2.89-2.91(2H, m), 3.71(3H, s), 3.91-4.04(4H, m), 5.19(2H, s), 5.79(1H, s), 6.87(1H, d, J=8.8Hz), 7.16(1H, d, J=8.8Hz), 7

. 51-7. 74 (4 H, m), 8. 09-8. 10 (1 H, m), 8. 32 (1 H, d, J=2. 0 Hz)。

【0477】

参考例29

8-メトキシ-1-(6-チオフェン-3-イルピリジン-3-イルメチル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)-8-メトキシ-1-(6-チオフェン-3-イルピリジン-3-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン0. 4 g のアセトン (8 ml) 及び水 (4 ml) 混合溶液に、ピリジニウムパラトルエンスルホナート (PPTS) 0. 24 g を加えて 1. 5 時間加熱還流した。減圧下に濃縮し、ジクロロメタンで抽出し、水で洗浄し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後減圧濃縮し、淡褐色無定形固体の 8-メトキシ-1-(6-チオフェン-3-イルピリジン-3-イルメチル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを 0. 4 g (収率定量的) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 51-2. 58 (2 H, m), 3. 34-3. 41 (2 H, m), 3. 81 (3 H, s), 5. 19 (2 H, s), 7. 09 (1 H, d, J=8. 8 Hz), 7. 54-7. 74 (5 H, m), 8. 09-8. 10 (1 H, m), 8. 35 (1 H, d, J=1. 8 Hz), 10. 03 (1 H, s)。

【0478】

参考例30

5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)-1-フェニル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン 2. 30 g (10. 5 ミリモル), ヨードベンゼン 3. 5 ml (31. 5 ミリモル), よう化銅 (I) 400 mg (2. 10 ミリモル), trans-1, 2-ジアミノシクロヘキサン 0. 129 ml (1. 05 ミリモル), 炭酸セシウム 6. 84 g (21. 0 ミリモル) を 1, 4-ジオキサン 30 ml 中、還流下に三夜攪拌した。冷後、不溶物をセライトパットで濾別し、濾液に酢酸エチル、水を加えて、水洗 (水×2, 飽和食塩水×1)、乾燥 (MgSO₄)、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (酢酸エチル: n-ヘキサン = 1 : 3 → 1 : 1) にて精製し、2. 91 g (92%) の白色固体 5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)-1-フェニル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 75-2. 90 (2 H, m), 3. 11-3. 27 (2 H, m), 3. 98-4. 25 (4 H, m), 5. 99 (1 H, s), 6. 39 (1 H, d, J=7. 6 Hz), 7. 05 (1 H, t, J=8. 0 Hz), 7. 16-7. 30 (3 H, m), 7. 35-7. 56 (3 H, m)。

【0479】

参考例31

1-フェニル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)-1-フェニル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン 2. 60 g の THF (30 ml) 溶液に 2N-塩酸 5 ml を加え、室温下一夜攪拌した。THF を減圧留去の後、酢酸エチル-水を加え、水洗 (水×2, 飽和食塩水×1)、乾燥 (MgSO₄)、減圧濃縮した。得られた固体をクロロホルム-ジエチルエーテルにて再結晶を行い、1. 93 g (87%) のベージュ粉末 1-フェニル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 75-2. 89 (2 H, m), 3. 53-3. 68 (2 H, m), 6. 65 (1 H,

d d, J = 0. 9 Hz, J = 8. 2 Hz), 7. 15 - 7. 20 (3 H, m), 7. 39 - 7. 61 (4 H, m), 10. 24 (1 H, s)。

【0480】

参考例32

5-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-8-カルボキサルデヒドの合成

5-メトキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン 5. 00 g (26ミリモル) をジクロロメタン 100 ml に溶解し、0℃でジクロロメチルメチルエーテル 7. 65 ml (85ミリモル) を加えた。10℃以下で四塩化チタン 12. 4 ml (113ミリモル) を滴下した。室温で2時間攪拌し、反応液を氷水に注ぎ、分液した。水層をジクロロメタンで抽出し、合わせた有機層を水で2回洗浄し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後減圧濃縮した。残渣をジクロロメタンに溶解し、ジエチルエーテルを加え、生成した不溶物を濾取乾燥して、淡褐色粉末の5-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-8-カルボキサルデヒド 5. 32 g (収率92%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 55 - 2. 67 (2 H, m), 2. 90 - 3. 04 (2 H, m), 3. 94 (3 H, s), 6. 69 (1 H, d, J = 8. 6 Hz), 7. 53 (1 H, d, J = 8. 6 Hz), 9. 79 (1 H, s), 10. 60 (1 H, br s)。

【0481】

参考例33

5-メトキシ-8-メチル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

5-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-8-カルボキサルデヒド 1. 00 g 及び 10% パラジウム炭素 100 mg を、酢酸 10 ml 及びエタノール 10 ml の混合溶媒に加え、50℃で1時間接触還元した。触媒を濾過して除き、濾液を減圧下に濃縮した。残渣を酢酸エチルで抽出し、水で2回洗浄し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後減圧濃縮した。残渣を酢酸エチル-ジエチルエーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の5-メトキシ-8-メチル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを 826 mg (収率89%) 得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 04 (3 H, s), 2. 54 - 2. 65 (2 H, m), 2. 89 - 3. 02 (2 H, m), 3. 81 (3 H, s), 6. 51 (1 H, d, J = 8. 4 Hz), 6. 97 (1 H, d, J = 8. 4 Hz), 7. 37 (1 H, br s)。

【0482】

参考例34

5-ヒドロキシ-8-メチル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

5-メトキシ-8-メチル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン 10. 0 g のジクロロメタン溶液 (100 ml) に -20℃で 2N-三臭化ホウ素ジクロロメタン溶液 52 ml を滴下して加えた。1時間攪拌して反応液を氷水に注ぎ、分液した。水で2回洗浄し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後減圧濃縮した。残渣を酢酸エチル-ジエチルエーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の5-ヒドロキシ-8-メチル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを 9. 4 g (収率定量的) 得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 14 (3 H, s), 2. 60 - 2. 65 (2 H, m), 2. 94 - 2. 99 (2 H, m), 5. 50 (1 H, br s), 6. 45 (1 H, d, J = 8. 2 Hz), 6. 88 (1 H, d, J = 8. 2 Hz), 7. 40 (1 H, br s)。

【0483】

参考例35

8-メチル-5-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリンの合成

5-ヒドロキシ-8-メチル-3, 4-ジヒドロー-1H-キノリン-2-オン 9. 0 g の無水ジクロロメタン溶液 (30 ml) に、0℃攪拌下、ピリジン 6. 2 ml 及びトリフルオロメタンスルホン酸無水物 10. 3 ml を加えて1時間攪拌した。減圧下に濃縮し、残渣に水を加えてジクロロメタンで抽出した。水、硫酸水素カリウム水溶液、水の順で洗浄後無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して、淡褐色粉末の8-メチル-5-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリンを28 g (収率97%) 得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 26 (3H, s), 2. 60-2. 73 (2H, m), 2. 99-3. 12 (2H, m), 6. 89 (1H, d, J=8. 5 Hz), 7. 11 (1H, d, J=8. 5 Hz), 7. 67 (1H, br s)。

【0484】

参考例 3 6

5-シアノ-8-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリンの合成

8-メチル-5-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン 4. 0 g、青酸亜鉛 3. 34 g、テトラキストリフェニルホスフインパラジウム 0. 299 g を DMF 40 ml に懸濁し、100℃で4時間攪拌した。不溶物を濾過して除き、濾液に酢酸エチルを加えて水洗した。無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮後残渣を DMF-エタノール混合溶媒から再結晶して、淡褐色粉末の5-シアノ-8-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリンを 2. 1 g (収率87%) 得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 31 (3H, s), 2. 64-2. 75 (2H, m), 3. 15-3. 27 (2H, m), 7. 14 (1H, d, J=7. 9 Hz), 7. 24 (1H, d, J=7. 9 Hz), 7. 67 (1H, br s)。

【0485】

参考例 3 7

8-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

5-シアノ-8-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン 2. 0 g 及びラネーニッケル 10 g を蟻酸 40 ml に懸濁し、6時間加熱還流した。反応液を濾過して不溶物を除き、濾液を濃縮した。残渣に酢酸エチル及び水を加えて攪拌後、セライト濾過した。濾液を分液し、有機層を水洗した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジエチルエーテル混合溶媒から再結晶して、淡褐色粉末の8-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを 1. 29 g (収率62%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 30 (3H, s), 2. 37-2. 50 (2H, m), 3. 28-3. 43 (2H, m), 7. 26 (1H, d, J=7. 8 Hz), 7. 44 (1H, d, J=7. 8 Hz), 9. 56 (1H, s), 10. 15 (1H, s)。

【0486】

参考例 3 8

5-メトキシ-8-フェニル-3, 4-ジヒドロー-1H-キノリン-2-オンの合成

8-プロモ-5-メトキシ-3, 4-ジヒドロー-1H-キノリン-2-オン 10. 0 g、テトラキストリフェニルホスフインパラジウム 0. 45 g 及び炭酸カリウム 5. 4 g をジオキサン 100 ml に懸濁し、フェニルボロン酸 5. 24 g を加え、アルゴン雰囲気下2時間加熱還流した。反応液を減圧下に濃縮し、残渣に水を加えて酢酸エチルで抽出し、水で2回洗浄し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後減圧濃縮した。残渣を酢酸エチル-n-ヘキサン混合溶媒から再結晶して、淡黄色粉末の5-メトキシ

-8-フェニル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを8. 3 g (収率84%) 得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 57-2. 64 (2H, m), 2. 97-3. 04 (3H, m), 3. 88 (2H, s), 6. 66 (1H, d, J=8. 5 Hz), 7. 09 (1H, d, J=8. 5 Hz), 7. 27-7. 52 (6H, m)。

【0487】

参考例39

1-(ビフェニル-4-イルメチル)-5-メトキシ-8-フェニル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

5-メトキシ-8-フェニル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン5. 0 g のDMF溶液(50m1)に0℃で水素化ナトリウム(60%油性)0. 87 gを加えて30分攪拌した。これに4-プロモメチルビフェニル5. 37 gを加えて室温で1時間攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10→1:5)で精製した。酢酸エチル-n-ヘキサン-ジエチルエーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の1-(ビフェニル-4-イルメチル)-5-メトキシ-8-フェニル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを6. 8 g (収率82%) 得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 64-2. 70 (2H, m), 2. 84-2. 96 (2H, m), 3. 86 (3H, s), 4. 49 (2H, s), 6. 73 (1H, d, J=8. 6 Hz), 6. 91 (2H, d, J=8. 1 Hz), 7. 13 (1H, d, J=8. 6 Hz), 7. 24-7. 55 (12H, m)。

【0488】

参考例40

1-(ビフェニル-4-イルメチル)-5-ヒドロキシ-8-フェニル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

1-(ビフェニル-4-イルメチル)-5-メトキシ-8-フェニル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン5. 00 g のジクロロメタン溶液(50m1)に-20℃で2N-三臭化ホウ素のジクロロメタン溶液12m1を滴下して加えた。4時間攪拌して反応液を氷水に注ぎ、分液した。水で2回洗浄し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥、濾過後、減圧濃縮した。残渣をジクロロメタン-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の1-(ビフェニル-4-イルメチル)-5-ヒドロキシ-8-フェニル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを5. 01 g (収率定量的) 得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 66-2. 74 (2H, m), 2. 84-2. 90 (2H, m), 4. 48 (2H, s), 5. 84 (1H, br s), 6. 61 (1H, d, J=8. 4 Hz), 6. 92 (2H, d, J=8. 2 Hz), 7. 01 (1H, d, J=8. 4 Hz), 7. 22-7. 54 (12H, m)。

【0489】

参考例41

1-(ビフェニル-4-イルメチル)-8-フェニル-5-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

1-(ビフェニル-4-イルメチル)-5-ヒドロキシ-8-フェニル-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン4. 0 g の無水ジクロロメタン溶液(40m1)に0℃攪拌下、ピリジン1. 12m1及びトリフルオロメタンスルホン酸無水物1. 99m1を加えて1時間攪拌した。減圧下に濃縮し、残渣に水を加えてジクロロメタンで抽出した。水、硫酸水素カリウム水溶液、水の順で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下

に濃縮して、白色無定形固体の1-(ビフェニル-4-イルメチル)-8-フェニル-5-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-3, 4-ジヒドロー1H-キノリン-2-オンを5.45g(収率定量的)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

2.67-2.81(2H, m), 2.90-3.03(2H, m), 4.48(2H, s), 6.85(2H, d, J=8.2Hz), 7.05-7.15(1H, m), 7.20-7.58(13H, m)。

【0490】

参考例42

1-(ビフェニル-4-イルメチル)-5-シアノ-8-フェニル-3, 4-ジヒドロー1H-キノリン-2-オンの合成

1-(ビフェニル-4-イルメチル)-8-フェニル-5-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-3, 4-ジヒドロー1H-キノリン-2-オン5.2g、青酸亜鉛2.50g及びテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム0.224gをDMF50m1に懸濁し、100℃で4時間攪拌した。不溶物を濾過して除き、濾液に酢酸エチルを加えて水洗した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮して白色無定形固体の1-(ビフェニル-4-イルメチル)-5-シアノ-8-フェニル-3, 4-ジヒドロー1H-キノリン-2-オンを2.1g(収率90%)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

2.75-2.82(2H, m), 3.09-3.15(2H, m), 4.48(2H, s), 6.85(2H, d, J=8.3Hz), 7.20-7.57(14H, m)。

【0491】

参考例43

1-(ビフェニル-4-イルメチル)-8-フェニル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

1-(ビフェニル-4-イルメチル)-5-シアノ-8-フェニル-3, 4-ジヒドロー1H-キノリン-2-オン3.0g及びラネーニッケル15gを蟻酸60m1に懸濁し、11時間加熱還流した。反応液を濾過して不溶物を除き、濾液を濃縮した。残渣に酢酸エチル及び水を加えて攪拌後、セライト濾過した。濾液を分液し、有機層を水洗した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:10→1:3)で精製した。得られる精製物を濃縮して白色無定形固体の1-(ビフェニル-4-イルメチル)-8-フェニル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを0.44g(収率15%)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

2.69-2.75(2H, m), 2.37-2.43(2H, m), 4.48(2H, s), 6.87(2H, d, J=8.3Hz), 7.25-7.55(13H, m), 7.61(1H, d, J=8.0Hz), 10.20(1H, s)。

【0492】

参考例44

1-ベンジル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド5.0gのDMF溶液(50m1)に、0℃で水素化ナトリウム(60%油性)1.07gを加えて30分攪拌した。これに臭化ベンジル3, 47m1を加えて室温で1時間攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を酢酸エチル-n-ヘキサン混合溶媒から再結晶して、白色粉末の1-ベンジル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを6.6g(収率92%)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

2. 60 (2H, t, J = 7. 0 Hz), 3. 38 (2H, t, J = 7. 0 Hz), 3. 82 (3H, s), 5. 29 (2H, s), 6. 82 (1H, d, J = 8. 6 Hz), 7. 0-7. 3 (5H, m), 7. 5 (1H, d, J = 8. 6 Hz), 10. 00 (1H, s)。

【0493】

参考例45

1-ベンジル-8-ヒドロキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

1-ベンジル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド 3. 0 g 及びナトリウム-4-メチルベンゼンチオラート 3. 27 g を DMSO 30 ml に加え、100°Cで40分攪拌した。反応液に水及び硫酸水素カリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を酢酸エチル-n-ヘキサン混合溶媒から再結晶して、淡褐色粉末の 1-ベンジル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを 6. 6 g (収率 92%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 42-2. 59 (2H, m), 3. 19-3. 40 (2H, m), 5. 31 (2H, s), 6. 85 (1H, d, J = 8. 5 Hz), 7. 05-7. 27 (5H, m), 7. 43 (1H, d, J = 8. 5 Hz), 9. 94 (1H, s), 11. 12 (1H, s)。

【0494】

参考例46

1-(4-カルボメトキシベンジル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドの合成

8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド 13. 4 g の DMF 溶液 (100 ml) に、0°Cで水素化ナトリウム (60%油性) 2. 87 g を加えて30分攪拌した。これに4-プロモメチル安息香酸メチル 18. 0 g を加えて室温で一夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (酢酸エチル: n-ヘキサン = 1: 4 → 1: 2) で精製した。クロロホルム-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の 1-(4-カルボメトキシベンジル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒドを 14. 43 g (収率 62%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 50-2. 61 (2H, m), 3. 29-3. 41 (2H, m), 3. 71 (3H, s), 3. 79 (3H, s), 5. 18 (2H, s), 7. 06 (1H, d, J = 8. 7 Hz), 7. 25 (2H, d, J = 8. 2 Hz), 7. 60 (1H, d, J = 8. 7 Hz), 7. 81 (2H, d, J = 8. 2 Hz), 10. 02 (1H, s)。

【0495】

参考例41と同様にして、下記参考例47~50の化合物を合成した。

【0496】

参考例47

8-クロロ-5-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2. 63-2. 75 (2H, m), 3. 02-3. 15 (2H, m), 6. 94 (1H, d, J = 8. 9 Hz), 7. 34 (1H, d, J = 8. 9 Hz), 7. 85 (1H, br s)。

【0497】

参考例48

6-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オ

ン

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2.60-2.73 (2H, m), 3.01 (2H, t, J=8.0Hz), 6.81-6.92 (1H, m), 7.00-7.12 (2H, m), 9.09 (1H, brs)。

【0498】

参考例49

7-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2.60-2.71 (2H, m), 3.00 (2H, t, J=8.0Hz), 6.70-6.77 (1H, m), 6.84-6.95 (1H, m), 7.16-7.30 (1H, m), 8.80 (1H, brs)。

【0499】

参考例50

8-トリフルオロメタンスルホニルオキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

2.63-2.75 (2H, m), 3.05 (2H, t, J=7.9Hz), 7.03 (1H, t, J=7.9Hz), 7.12-7.28 (2H, m), 7.78 (1H, brs)。

【0500】

参考例51

6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナントリジン-2-カルボニトリルの合成

2-(5, 5-ジメチル-[1, 3, 2]ジオキサボリナン-2-イル)-安息香酸エチルエステル 19.84 g、2-ヨード-4-シアノアニリン 18.47 g、テトラキストリフェニルfosfiniumパラジウム 8.75 g 及びリン酸カリウム 35.36 g をジオキサン 360mL に加え、この混合物を終夜で加熱還流した。反応溶媒を冷却し、生じた固体を濾取し、水洗し、乾燥し、標記化合物 17.3 g を黄色固体として得た（収率定量的）。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

7.47 (1H, d, J=8.5Hz), 7.6-8.0 (3H, m), 8.1-8.2 (1H, m), 8.3-8.4 (1H, m), 8.98 (1H, s), 12.05 (1H, brs)。

【0501】

参考例52

5-ベンジル-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナントリジン-2-カルボニトリルの合成

6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナントリジン-2-カルボニトリル 1 g を DMF 20mL に懸濁させ、氷冷下 60% 水素化ナトリウム 0.2 g を加え水素の発生が止まるまで攪拌し、臭化ベンジル 0.59 mL を加え、室温で 1 時間攪拌した。水を加え、生じた固体を濾取し、シリカゲルクロマトグラフィー（ジクロロメタン：n-ヘキサン = 1 : 1）で精製し表題の化合物を 0.68 g 無色結晶として得た。（収率 48%）。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

5.57 (2H, s), 7.1-7.5 (6H, m), 7.6-7.95 (3H, m), 8.27 (1H, d, J=8.3Hz), 8.58 (1H, d, J=1.8Hz), 8.63 (1H, dd, J=8.3Hz, J=1.8Hz)。

【0502】

参考例52と同様にして、下記参考例53～54の化合物を合成した。

【0503】

参考例53

5-エチル-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナントリジン-2-カルボニトリル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 43 (3H, t, J=7. 1 Hz), 4. 47 (2H, t, J=7. 1 Hz), 7. 35-7. 9 (4H, m), 8. 27 (1H, d, J=8. 3 Hz), 8. 5-8. 65 (2H, m)。

【0504】

参考例54

5-(1-ビフェニル-4-イルメチル)-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナントリジン-2-カルボニトリル

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

5. 57 (2H, s), 7. 1-7. 5 (6H, m), 7. 6-7. 95 (3H, m), 8. 27 (1H, d, J=8. 3 Hz), 8. 58 (1H, d, J=1. 8 Hz), 8. 63 (1H, dd, J=8. 3 Hz, J=1. 8 Hz)。

【0505】

参考例55

5-ベンジル-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナントリジン-2-カルボキサルデヒドの合成

5-ベンジル-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナントリジン-2-カルボニトリル
1. 24 g 及びラネーニッケル0. 8 g を 75% 蟻酸 25 ml に懸濁し、1時間40分
加熱還流し、熱時濾過した。濾液を濃縮し、シリカゲルクロマトグラフィー (メチレンク
ロリド:メタノール=50:1) で精製し、表題の化合物を 1. 08 g 無色結晶として得
た (収率 80%)。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

5. 69 (2H, s), 7. 15-7. 35 (6H, m), 7. 5-8. 05 (3H, m)
, 8. 47 (1H, d, J=7. 9 Hz), 8. 70 (1H, d, J=8. 1 Hz),
8. 63 (1H, d, J=1. 4 Hz), 10. 08 (1H, s)。

【0506】

参考例55と同様にして、参考例56の化合物を合成した。

参考例56

5-エチル-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナントリジン-2-カルボキサルデヒド

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 45 (3H, t, J=7. 1 Hz), 4. 50 (2H, t, J=7. 1 Hz), 7.
15-7. 35 (6H, m), 7. 5-8. 15 (4H, m), 8. 39 (1H, d, J
=8. 1 Hz), 8. 56 (1H, dd, J=8. 1 Hz, J=1. 3 Hz), 8. 81
(1H, d, J=1. 8 Hz), 10. 11 (1H, s)。

【0507】

参考例13と同様にして、下記参考例104~130、133~134及び137~1
41の化合物を合成した。

【0508】

参考例19と同様にして、下記参考例147~148の化合物を合成した。

【0509】

参考例21と同様にして、下記参考例57~63の化合物を合成した。

【0510】

参考例23と同様にして、下記参考例144~146及び152~156の化合物を合
成した。

【0511】

参考例24と同様にして、下記参考例70~71及び81の化合物を合成した。

【0512】

参考例25と同様にして、下記参考例64~69、72、79~80及び82~83の
化合物を合成した。

【0513】

参考例26と同様にして、下記参考例75～77の化合物を合成した。

【0514】

参考例28と同様にして、下記参考例74及び78の化合物を合成した。

【0515】

参考例29と同様にして、下記参考例98、100～103、131、135～136、140及び146の化合物を合成した。

【0516】

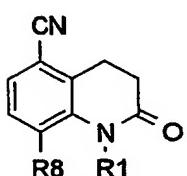
参考例31と同様にして、下記参考例84～97及び142の化合物を合成した。

【0517】

参考例37と同様にして、下記参考例149～151の化合物を合成した。

【0518】

【表1】



参考例	R1	R8	1HNMR δ ppm
57	-H	-OCH ₃	CDCl ₃ :2.65-2.72 (2H, m), 3.15-3.22 (2H, m), 3.94 (3H, s), 6.86 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.32 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.82 (1H, brs)."
58	-H	-Cl	CDCl ₃ :2.82-2.68 (2H, m), 3.20-3.32 (2H, m), 7.27 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.38 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.85 (1H, brs).

【0519】

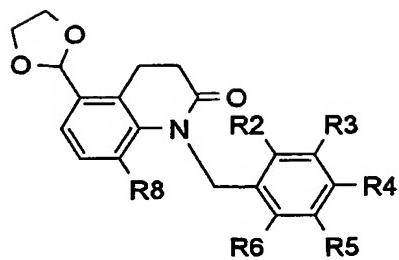
【表2】



参考例 R1	R8	1HNMR δ ppm
59 -H	-H	DMSO-d6:2.41-2.55 (2H, m), 2.91 (2H, t, J = 7.9 Hz), 6.96 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.55-7.67 (2H, m), 10.49 (1H, brs).
60 -H	-CH ₃	CDCl ₃ :2.67 (3H, s), 2.61-2.72 (2H, m), 2.94-3.08 (2H, m), 7.30-7.39 (2H, m), 7.66 (1H, brs).
61 -H	-OCH ₃	CDCl ₃ :2.62-2.69 (2H, m), 2.96-3.03 (2H, m), 3.91 (3H, s), 7.01 (1H, s), 7.13 (1H, s), 7.86 (1H, brs).
62		CDCl ₃ :2.65-2.71 (2H, m), 2.85-2.92 (2H, m), 3.78 (3H, s), 5.38 (2H, s), 6.98 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.10 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.30-7.36 (1H, m), 7.36-7.49 (4H, m), 7.49-7.59 (2H, m).
63		CDCl ₃ :2.40 (3H, s), 2.57-2.70 (2H, m), 2.77-2.90 (2H, m), 5.17 (2H, s), 7.13 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.29-7.37 (3H, m), 7.37-7.50 (4H, m), 7.50-7.90 (2H, m).

【0520】

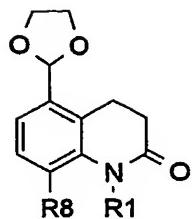
【表3】



参考例	R2	R3	R4	R5	R6	R8	1HNMR	δ ppm
64	-H	-H	-Br	-H	-H	-H	CDCl ₃ :	2.70-2.83 (2H, m), 3.01-3.16 (2H, m), 3.97-4.22 (4H, m), 5.12 (2H, s), 5.95 (1H, s), 6.85 (1H, dd, J = 0.8, 8.1 Hz), 7.02-7.19 (3H, m), 7.22-7.31 (1H, m), 7.38-7.50 (2H, m).
65	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	CDCl ₃ :	2.68-2.82 (2H, m), 3.02-3.17 (2H, m), 3.97-4.20 (4H, m), 5.14 (2H, s), 5.95 (1H, s), 6.84 (1H, dd, J = 0.8, 8.1 Hz), 7.05-7.18 (3H, m), 7.20-7.33 (3H, m).
66	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	CDCl ₃ :	2.30 (3H, s), 2.68-2.82 (2H, m), 3.01-3.16 (2H, m), 3.97-4.20 (4H, m), 5.14 (2H, s), 5.95 (1H, s), 6.91 (1H, dd, J = 0.8, 8.1 Hz), 7.04-7.17 (5H, m), 7.24 (1H, dd, J = 0.8, 8.1).
67	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	-OCH ₃	CDCl ₃ :	2.55-2.66 (2H, m), 2.87-2.99 (2H, m), 3.74 (3H, s), 3.96-4.18 (4H, m), 5.25 (2H, s), 5.84 (1H, s), 6.75 (1H, d, J = 8.7 Hz), 6.84 (2H, d, J = 8.6 Hz), 6.94 (2H, dd, J = 1.1, 8.7 Hz), 7.03-7.22 (3H, m), 7.22-7.36 (3H, m).
68	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	-H	CDCl ₃ :	2.75-2.81 (2H, m), 3.09-3.15 (2H, m), 3.89 (3H, s), 4.04-4.17 (4H, m), 5.23 (2H, s), 5.96 (1H, s), 6.80 (1H, d, J=7.9Hz), 7.11 (1H, t, J=7.9Hz), 7.25-7.28 (3H, m), 7.98 (2H, d, J=8.3Hz)
69	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	-H	CDCl ₃ :	2.76-2.82 (2H, m), 3.10-3.16 (2H, m), 4.05-4.15 (4H, m), 5.27 (2H, s), 5.96 (1H, s), 6.76 (1H, d, J=8.0Hz), 7.14 (1H, t, J=8.0Hz), 7.29 (1H, d, J=8.0Hz), 7.37 (2H, d, J=8.8Hz), 8.18 (2H, d, J=8.8Hz)

【0521】

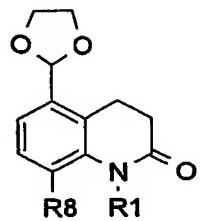
【表4】



参考例 R1	R8	1HNMR δ ppm
70 -H	-OCH ₃	DMSO-d6:2.33-2.44 (2H, m), 2.85-2.98 (2H, m), 3.79 (3H, s), 3.86-4.08 (4H, m), 5.78 (1H, s), 6.86 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.07 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.97 (1H, s).
71 -H	-H	CDCl ₃ :2.56-2.70 (2H, m), 3.01-3.18 (2H, m), 3.97-4.22 (4H, m), 5.93 (1H, s), 6.80 (1H, dd, J = 1.4, 7.6 Hz), 7.13-7.31 (2H, m), 8.52 (1H, s).
72		CDCl ₃ :2.77-2.89 (2H, m), 3.07-3.21 (2H, m), 3.98-4.19 (4H, m), 5.34 (2H, s), 5.96 (1H, s), 6.89-6.97 (1H, m), 7.02-7.12 (1H, m), 7.19-7.29 (1H, m), 7.31-7.40 (1H, m), 7.40-7.53 (2H, m), 7.61 (1H, s), 7.69-7.88 (3H, m).
73 -C ₆ H ₅	-H	CDCl ₃ :2.75-2.90 (2H, m), 3.11-3.27 (2H, m), 3.98-4.25 (4H, m), 5.99 (1H, s), 6.39 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.05 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.16-7.30 (3H, m), 7.35-7.56 (3H, m).
74		-OCH ₃ DMSO-d6: 2.49-2.55 (2H, m), 2.89-2.91 (2H, m), 3.70 (3H, s), 3.91-4.04 (4H, m), 5.20 (2H, s), 5.80 (1H, s), 6.89 (1H, d, J=8.7Hz), 7.18 (1H, d, J=8.7Hz), 7.42-7.67 (4H, m), 7.84 (1H, d, J=8.3Hz), 8.09-8.10 (1H, m), 8.42 (1H, d, J=1.8Hz)
75		-OCH ₃ DMSO-d6: 2.49-2.52 (2H, m), 2.77-2.80 (2H, m), 3.24-3.26 (4H, m), 3.61-3.63 (4H, m), 3.80 (3H, s), 3.90-4.02 (4H, m), 5.12 (2H, s), 6.65 (1H, d, J=8.5Hz), 6.88 (1H, d, J=8.5Hz), 7.15 (1H, d, J=8.5Hz), 7.25-7.28 (1H, m), 7.85 (1H, d, J=2.3Hz)

【0522】

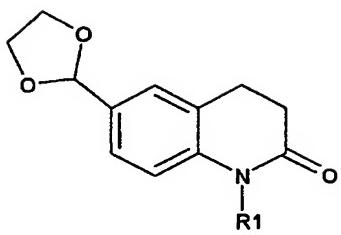
【表 5】



参考例 R1	R8	1H-NMR	δ ppm
76	-OCH ₃	CDCl ₃ :2.57-2.60 (2H, m), 2.86-2.89 (2H, m), 3.24-3.28 (4H, m), 3.59-3.63 (4H, m), 3.83 (3H, s), 3.99-4.13 (4H, m), 5.23 (2H, s), 5.81 (1H, s), 6.54 (1H, d, J=8.7Hz), 6.76 (1H, d, J=8.7Hz), 6.85-6.90 (1H, m), 6.96 (1H, d, J=8.4Hz), 7.22-7.34 (4H, m), 7.98 (1H, d, J=2.2Hz)	
77	-OCH ₃	CDCl ₃ :2.32 (3H, s), 2.46-2.50 (4H, m), 2.54-2.59 (2H, m), 2.85-2.90 (2H, m), 3.45-3.49 (4H, m), 3.82 (3H, s), 3.99-4.12 (4H, m), 5.22 (2H, s), 5.80 (1H, s), 6.49 (1H, d, J=8.7Hz), 6.75 (1H, d, J=8.7Hz), 7.24 (1H, d, J=8.7Hz), 7.30 (1H, d, J=2.3Hz), 7.95 (1H, d, J=2.3Hz)	
78	-OCH ₃	CDCl ₃ :2.62-2.66 (2H, m), 2.95-2.99 (2H, m), 3.71 (3H, s), 3.99-4.14 (4H, m), 5.31 (2H, s), 5.84 (1H, s), 6.74 (1H, d, J=8.7Hz), 7.23-7.29 (2H, m), 7.46-7.82 (2H, m), 8.22-8.33 (2H, m), 8.47-8.48 (1H, m), 8.63-8.65 (1H, m)	
79	-OCH ₃	CDCl ₃ :2.69-2.74 (2H, m), 3.11-3.16 (2H, m), 3.45 (3H, s), 4.03-4.17 (4H, m), 5.36 (2H, s), 5.91 (1H, s), 6.72 (1H, d, J=8.6Hz), 7.25-7.31 (2H, m), 7.44-7.50 (1H, m), 7.64-7.69 (1H, m), 7.76 (1H, d, J=8.1Hz), 8.02 (2H, t, J=9.3Hz)	
80	-H	CDCl ₃ :2.72-2.78 (2H, m), 3.06-3.12 (2H, m), 4.02-4.17 (4H, m), 5.17 (2H, s), 5.94 (1H, s), 6.84 (1H, d, J=8.1Hz), 7.13-7.31 (2H, m), 7.49 (1H, dd, J1=2.5Hz, J2=8.2Hz), 8.32 (1H, d, J=2.5Hz)	

【0523】

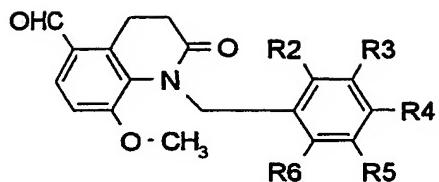
【表6】



参考例 R1	$^1\text{H}\text{NMR}$ δ ppm
81 -H	DMSO- δ 6:2.35-2.51 (2H, m), 2.86 (2H, t, J = 7.9 Hz), 3.84-4.08 (4H, m), 5.61 (1H, s), 6.83 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.12-7.25 (2H, m), 10.12 (1H, s).
82	CDCl3:2.71-2.82 (2H, m), 2.91-3.06 (2H, m), 3.94-4.18 (4H, m), 5.12 (2H, s), 5.71 (1H, s), 6.81 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.07 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.15-7.27 (1H, m), 7.31 (1H, d, J = 1.7 Hz), 7.35-7.46 (2H, m).
83	CDCl3:2.73-2.87 (2H, m), 2.94-3.10 (2H, m), 3.97-4.20 (4H, m), 5.26 (2H, s), 5.71 (1H, s), 6.74 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.22 (1H, dd, J = 1.9, 8.4 Hz), 7.30-7.41 (3H, m), 8.16 (2H, d, J = 8.7 Hz).

【0524】

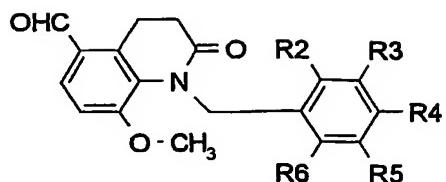
【表7】



参考例	R2	R3	R4	R5	R6	¹ H NMR	δ ppm
84	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	CDCl ₃ : 2.62(2H, t, J=7.0Hz), 3.41(2H, t, J=7.0Hz), 3.86(3H, s), 5.33(2H, s), 6.86(1H, d, J=8.6Hz), 7.15(1H, d, J=8.6Hz), 7.25-7.6(5H, m), 10.00(1H, s)	
85	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	CDCl ₃ : 1.23(9H, s), 2.55-2.65(2H, m), 3.3-3.4(2H, m), 3.86(3H, s), 5.27(2H, s), 6.86(1H, d, J=8.6Hz), 7.00(2H, d, J=7.3Hz), 7.19(2H, d, J=7.3Hz), 7.52(1H, d, J=8.6Hz), 10.02(1H, s)	
86	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	CDCl ₃ : 2.63(2H, t, J=7.0Hz), 3.42(2H, t, J=7.0Hz), 3.84(3H, s), 5.36(2H, s), 6.85(1H, d, J=8.6Hz), 7.06(1H, d, J=7.4Hz), 7.2-7.65(7H, m), 10.02(1H, s)	
87	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	CDCl ₃ : 2.52(2H, t, J=7.0Hz), 3.18(2H, t, J=7.0Hz), 3.45(3H, s), 5.34(2H, s), 6.67(1H, d, J=8.6Hz), 7.06(1H, d, J=7.4Hz), 7.1-7.5(10H, m), 9.98(1H, s)	
88	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	DMSO-d6: 2.52-2.65 (2H, m), 2.34-2.46 (2H, m), 3.66 (3H, s), 5.16 (2H, s), 7.09 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.41 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.63 (1H, d, J = 8.7 Hz), 8.11 (2H, d, J = 8.6 Hz), 10.04 (1H, s).	
89	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-H	DMSO-d6: 2.4-2.64 (2H, m), 3.20-3.50 (2H, m), 3.73 (3H, s), 5.19 (2H, s), 7.06 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.22 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.60 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.0 Hz), 10.01 (1H, s), 12.80 (1H, brs).	

【0525】

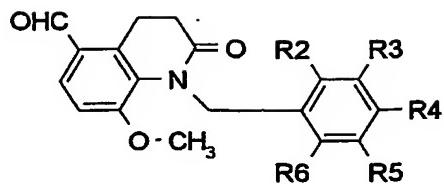
【表8】



参考例	R2	R3	R4	R5	R6	$^1\text{HNMR}$ δ ppm :
90	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	DMSO-d6:2.40-2.59 (2H, m), 3.17-3.38 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.87 (3H, s), 5.16 (2H, s), 6.73 (2H, d, J = 8.5 Hz), 6.99 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.06 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.58 (1H, d, J = 8.7 Hz), 9.98 (1H, s).
91	-H	-H	-Cl	-H	-H	CDCl ₃ :2.60 (2H, t, J = 7.0 Hz), 3.39 (2H, t, J = 7.0 Hz), 3.82 (3H, s), 5.23 (2H, s), 6.86 (1H, d, J = 8.6 Hz), 6.98-7.06 (2H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.54 (1H, d, J = 8.6 Hz), 10.02 (1H, s).
92	-H	-H	-Br	-H	-H	DMSO-d6:2.42-2.60 (2H, m), 3.22-3.39 (2H, m), 3.77 (3H, s), 5.12 (2H, s), 7.00-7.15 (3H, m), 7.38 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.60 (1H, d, J = 8.7 Hz), 10.00 (1H, s).
93	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	CDCl ₃ :2.53-2.63 (2H, m), 3.29-3.40 (2H, m), 3.87 (3H, s), 4.96 (2H, s), 5.25 (2H, s), 6.78 (2H, dd, J = 2.1, 6.7 Hz), 6.85 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.00 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.25-7.42 (5H, m), 7.51 (1H, d, J = 8.6 Hz), 10.00 (1H, s).
94	-H	-H	-F	-H	-H	DMSO-d6:2.44-2.58 (2H, m), 3.23-3.38 (2H, m), 3.80 (3H, s), 5.16 (2H, s), 6.94-7.19 (5H, m), 7.59 (1H, d, J = 8.7 Hz), 10.00 (1H, s).
95	-H	-H	-CN	-H	-H	DMSO-d6:2.50-2.64 (2H, m), 3.32-3.45 (2H, m), 3.66 (3H, s), 5.13 (2H, s), 7.08 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.32 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.63 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.69 (2H, d, J = 8.2 Hz), 10.04 (1H, s).
96	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	CDCl ₃ :2.23 (3H, s), 2.55-2.62 (2H, m), 3.32-3.39 (2H, m), 3.86 (3H, s), 5.28 (2H, s), 6.84 (1H, d, J = 8.6 Hz), 6.90-7.11 (4H, m), 7.51 (1H, d, J = 8.6 Hz), 10.00 (1H, s).

【0526】

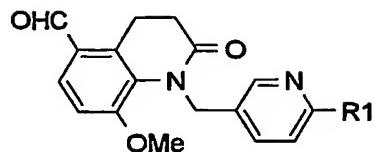
【表9】



参考例	R2	R3	R4	R5	R6	1H-NMR	δ ppm
97	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	CDCl ₃ : 2.60 (2H, t, J = 7.0 Hz), 3.37 (2H, t, J = 7.0 Hz), 3.86 (3H, s), 5.27 (2H, s), 6.75-6.97 (5H, m), 7.00-7.12 (3H, m), 7.22-7.37 (2H, m), 7.54 (1H, d, J = 8.6 Hz), 10.02 (1H, s).	
98	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	CDCl ₃ : 2.77-2.83 (2H, m), 3.51-3.57 (2H, m), 3.90 (3H, s), 5.26 (2H, s), 7.03 (1H, d, J=8.2Hz), 7.26-7.32 (3H, m), 7.50 (2H, dd, J1=0.9Hz, J2=7.7Hz), 10.21 (1H, s)	

【0527】

【表10】



参考例 R1	¹ H NMR δ ppm :
99 -C ₆ H ₅	DMSO-d6: 2.52-2.59 (2H, m), 3.18-3.25 (2H, m), 3.81 (3H, s), 5.21 (2H, s), 7.11 (1H, d, J=8.8Hz), 7.39-7.66 (5H, m), 7.83 (1H, d, J=8.0Hz), 8.01-8.03 (1H, m), 8.44-8.45 (1H, m), 10.04 (1H, s)
100 -2-PYRIDYL	CDCl ₃ : 2.61-2.67 (2H, m), 3.39-3.45 (2H, m), 3.83 (3H, s), 5.34 (2H, s), 6.85 (1H, d, J=8.6Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.46-7.82 (3H, m), 8.24 (1H, d, J=8.2Hz), 8.30 (1H, J=8.0Hz), 8.45 (1H, d, J=1.8Hz), 8.64 (1H, d, 4.7Hz), 10.01 (1H, s)
101	 DMSO-d6: 2.47-2.52 (2H, m), 3.23-3.33 (6H, m), 3.61-3.65 (4H, m), 3.90 (3H, s), 5.12 (2H, s), 6.67 (1H, d, J=8.8Hz), 7.11 (1H, d, J=8.7Hz), 7.29 (1H, dd, J1=2.2Hz, J2=8.8Hz), 7.61 (1H, d, 8.7Hz), 7.87 (1H, d, J=2.2Hz), 10.00 (1H, s)
102	 CDCl ₃ : 2.55-2.60 (2H, m), 3.23-3.27 (4H, m), 3.30-3.36 (2H, m), 3.58-3.62 (4H, m), 3.94 (3H, s), 5.24 (2H, s), 6.54 (1H, d, J=8.8Hz), 6.85-6.97 (4H, m), 7.24-7.31 (3H, m), 7.53 (1H, d, J=8.6Hz), 7.93 (1H, d, J=2.2Hz), 9.99 (1H, s)
103	 CDCl ₃ : 2.31 (3H, s), 2.45-2.49 (4H, m), 2.54-2.60 (2H, m), 3.29-3.35 (2H, m), 3.44-3.48 (4H, m), 3.94 (3H, s), 3.99-4.12 (4H, m), 5.22 (2H, s), 6.48 (1H, d, J=8.7Hz), 6.88 (1H, d, J=8.6Hz), 7.23-7.28 (1H, m), 7.52 (1H, d, J=8.6Hz), 7.90 (1H, d, J=2.2Hz), 9.99 (1H, s)

【0528】

【表 11】



参考例 R1	^1H NMR δ ppm :
104 $-(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{OCH}_2\text{OCH}_3$	CDCI3 : 1.20(6H, s), 1.89 (2H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.45 (3H, s), 3.27 (3H, s), 4.18 (2H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 4.62 (2H, s), 7.35 (2H, d , $J=8.3\text{Hz}$), 7.80 (2H, d, $J=8.3\text{Hz}$)
105 $-(\text{CH}_2)_3\text{CF}_3$	CDCI3 : 1.8-2.2(4H, m), 2.5-2.6(2H, m), 3.3-3.45(2H, m), 3.9-4.05(2H, m), 3.97(3H, s), 7.00(1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.61(1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 10.06(1H, s)
106 $-\text{C}_4\text{H}_9$	CDCI3 : 0.85(3H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 1.2-1.35(2H, m), 1.4-1.5(2H, m), 2.51(2H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 3.35(2H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 3.96(3H, s), 4.04(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 6.98(1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.60(1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 10.06(1H, s)
107 $-\text{C}_2\text{H}_5$	CDCI3 : 1.15(3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.51(2H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 3.36(2H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 3.97(3H, s), 4.01(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 6.98(1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.60(1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 10.06(1H, s)
108 $-\text{C}_3\text{H}_7$	CDCI3 : 0.81(3H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 1.4-1.6(2H, m), 2.52(2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 3.36(2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 3.96(3H, s), 4.00(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 6.97(1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 7.59(1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 10.06(1H, s)
109 $-\text{C}_5\text{H}_{11}$	CDCI3 : 0.83(3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.1-1.3(4H, m), 1.4-1.5(2H, m), 2.52(2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 3.36(2H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 3.96(3H, s), 4.02(2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 6.97(1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 7.59(1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 10.06(1H, s)
110 $-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CDCI3 : 1.53(6H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 2.4-2.5(2H, m), 3.35-3.45(2H, m), 3.85-4.0(1H, m), 3.97(3H, s), 6.97(1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 7.59(1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 10.06(1H, s)
111 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CDCI3 : 0.76(6H, d, $J=6.6\text{Hz}$), 1.4-1.7(1H, m), 2.5-2.6(2H, m), 3.3-3.45(2H, m), 3.96(3H, s), 4.04(1H, d, $J=7.4\text{Hz}$), 6.97(1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 7.60(1H, t, $J=8.6\text{Hz}$), 10.07(1H, s)
112 $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CDCI3 : 1.42(9H, s), 2.55-2.65(2H, m), 3.4-3.55(2H, m), 3.81(3H, s), 4.60(2H, s), 6.97(1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.59(1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 10.07(1H, s)

【0529】

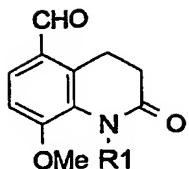
【表12】



参考例 R1	1H-NMR δ ppm
113 -(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	CDCl ₃ : 2.44(2H, t, J=7.0Hz), 2.82(2H, t, J=7.5Hz), 3.02(2H, t, J=7.0Hz), 4.01(3H, s), 4.32(2H, t, J=7.5Hz), 6.95-7.1(3H, m), 7.1-7.25(3H, m), 7.60(1H, d, J=8.6Hz), 10.03(1H, s)
114 -(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	CDCl ₃ : 1.75-1.95(2H, m), 2.5-2.65(4H, m), 3.36(2H, t, J=7.0Hz), 3.79(3H, s), 4.05(2H, t, J=7.4Hz), 6.93(1H, d, J=8.6Hz), 7.05-7.35(5H, m), 7.58(1H, d, J=8.6Hz), 10.05(1H, s)
115 -CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	CDCl ₃ : 0.1-0.4(4H, m), 0.8-0.9(1H, m), 2.53(2H, t, J=7.0Hz), 3.39(2H, t, J=7.0Hz), 3.97(3H, s), 4.01(2H, t, J=7.3Hz), 6.97(1H, d, J=8.6Hz), 7.61(1H, d, J=8.6Hz), 10.08(1H, s)
116 -CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CDCl ₃ : 2.54(2H, t, J=7.0Hz), 3.23(3H, s), 3.36(2H, t, J=7.0Hz), 3.47(2H, t, J=6.0Hz), 3.96(3H, s), 4.25(2H, t, J=6.0Hz), 6.96(1H, d, J=8.6Hz), 7.61(1H, d, J=8.6Hz), 10.07(1H, s)
117 -(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	CDCl ₃ : 2.54(2H, t, J=7.0Hz), 3.34(2H, t, J=7.0Hz), 3.93(3H, s), 4.16(2H, t, J=6.0Hz), 4.42(2H, t, J=6.0Hz), 6.72(1H, dd, J ₁ =8.8Hz, J ₂ =0.95Hz), 6.85-7.05(2H, m), 7.15-7.3(2H, m), 7.60(1H, d, J=8.6Hz), 10.05(1H, s)
118 -CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	CDCl ₃ : 0.8-1.75(11H, m), 2.5-2.6(2H, m), 3.3-3.45(2H, m), 3.96(3H, s), 4.06(2H, t, J=7.2Hz), 6.97(1H, d, J=8.6Hz), 7.60(1H, d, J=8.6Hz), 10.07(1H, s)
119 -(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	CDCl ₃ : 1.45-1.6(4H, m), 2.45-2.6(4H, m), 3.34(2H, t, J=7.0Hz), 3.85(3H, s), 4.02(2H, t, J=6.6Hz), 6.93(1H, d, J=8.6Hz), 7.05-7.35(5H, m), 7.58(1H, d, J=8.6Hz), 10.05(1H, s)

【0530】

【表13】



参考例 R1	1H-NMR δ ppm
120 -(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	CDCl ₃ : 1.15-1.3(2H, m), 1.42-1.61(4H, m), 2.4-2.6(4H, m), 3.28(2H, t, J=7.0Hz), 3.92(3H, s), 4.02(2H, t, J=7.4Hz), 6.96(1H, d, J=8.6Hz), 7.1-7.3(5H, m), 7.59(1H, d, J=8.6Hz), 10.05(1H, s)
121 -CH(C ₆ H ₅) ₂	CDCl ₃ : 2.52(2H, t, J=7.0Hz), 3.33(2H, t, J=7.0Hz), 3.48(3H, s), 6.30(1H, s), 6.81(1H, d, J=8.6Hz), 7.15-7.35(10H, m), 7.57(1H, d, J=8.6Hz), 10.00(1H, s)
122 -(CH ₂) ₃ CO ₂ C ₂ H ₅	CDCl ₃ : 1.24 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.79-1.94 (2H, m), 2.24 (2H, t, J = 7. Hz), 2.45-2.57 (2H, m), 3.36 (2H, t, J = 7.0 Hz), 3.97 (3H, s), 4.00-4.16 (4H, m), 6.99 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.60 (1H, d, J = 8.6 Hz), 10.06 (1H, s).
123 -CH ₂ CH ₂ CN	DMSO-d6: 2.37-2.49 (2H, m), 2.76 (2H, t, J = 6.8 Hz), 3.21-3.44 (2H, m), 3.96 (3H, s), 4.08 (2H, t, J = 6.8 Hz), 7.24 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.72 (1H, d, J = 8.7 Hz), 10.06 (1H, s).
124 -C ₆ H ₅	CDCl ₃ : 2.65-2.79 (2H, m), 3.41 (3H, s), 3.54 (2H, t, J = 7.0 Hz), 6.86 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.08-7.44 (5H, m), 7.61 (1H, d, J = 8.6 Hz), 10.09 (1H, s).
125 -CH ₂ CH=CH ₂	CDCl ₃ : 2.52-2.57(2H, m), 3.36-3.41(2H, m), 3.94(3H, s), 4.66(2H, dt, J = 6.0 and 1.3 Hz), 5.02-5.15(2H, m), 5.64-5.77(1H, m), 6.96(1H, d, J = 8.6 Hz), 7.59(1H, d, J = 8.6 Hz), 10.05(1H, s)
126 -C ₈ H ₁₇	CDCl ₃ : 0.85(3H, t, J = 6.7 Hz), 1.20-1.38(10H, m), 1.38-1.53(2H, m), 2.49-2.54(2H, m), 3.33-3.40(2H, m), 3.96(3H, s), 5.83(2H, t, J = 7.5 Hz), 6.98(1H, d, J = 8.6 Hz), 7.60(1H, d, J = 8.6 Hz), 10.06(1H, s)

【0531】

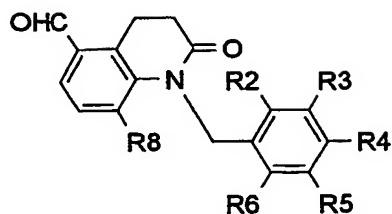
【表14】



参考例 R1	1H-NMR δ ppm
127	CDCl ₃ :0.9-1.2(2H, m), 1.42(9H, s), 1.25-1.85(3H, m), 2.4-2.7(4H, m), 3.2-3.6(2H, m), 3.8-4.2(4H, m), 3.96(3H, s), 6.99(1H, d, J=6.6Hz), 7.61(1H, d, J=6.6Hz), 10.06(1H, s)
128	CDCl ₃ :1.2-1.75(5H, m), 2.24(3H, s), 2.4-2.6(4H, m), 3.3-3.6(4H, m), 3.97(3H, s), 4.0-4.2(2H, m), 6.78(2H, d, J=8.5Hz), 6.95-7.1(3H, m), 7.61(1H, d, J=7.6Hz), 10.07(1H, s)
129	CDCl ₃ :2.65(2H, t, J=7.0Hz), 3.30(2H, t, J=7.0Hz), 3.76(3H, s), 5.78(2H, s), 6.78(1H, d, J=8.6Hz), 7.2-7.35(2H, m), 7.4-7.55(3H, m), 7.66(1H, d, J=8.1Hz), 7.79(1H, d, J=7.9Hz), 8.00(1H, d, J=8.5Hz), 9.93(1H, s)
130	CDCl ₃ :2.64(2H, t, J=7.0Hz), 3.42(2H, t, J=7.0Hz), 3.85(3H, s), 5.47(2H, s), 6.81(1H, d, J=8.6Hz), 7.19(1H, dd, J1=8.5Hz, J2=1.6Hz), 7.35-7.8(7H, m), 9.98(1H, s)
131	CDCl ₃ :2.68-2.74 (2H, m), 3.57-3.63 (2H, m), 3.62 (3H, s), 5.42 (2H,s), 6.85 (1H, d, J=8.6Hz), 7.28 (1H, d, J=8.5Hz), 7.47 (1H, ddd, J1=1.1Hz, J2=7.5Hz, J3=8.2Hz), 7.54 (1H, d, J=8.6Hz), 7.66 (1H, ddd, J1=1.1Hz, J2=7.5Hz, J3=8.5Hz), 7.76 (1H, dd, J1=1.1Hz, J2=8.2Hz), 7.96 (1H, d, J=8.5Hz), 8.04 (1H, d, J=8.5Hz)

【0532】

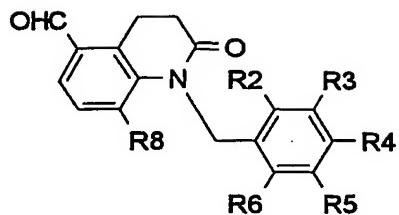
【表15】



参考例	R2	R3	R4	R5	R6	R8	1H-NMR δ ppm
132	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	-OH	CDCl ₃ :2.64(2H, t, J=7.0Hz), 3.41(2H, t, J=7.0Hz), 5.37(2H, s), 6.30(1H, br s), 6.80(1H, d, J=8.6Hz), 7.2-7.6(10H, m), 10.00(1H, s)
133	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	-OC ₄ H ₉	CDCl ₃ :0.94(3H, t, J=7.4Hz), 1.35-1.5(2H, m), 1.65-1.8(2H, m), 2.62(2H, t, J=7.0Hz), 3.41(2H, t, J=7.0Hz), 4.03(2H, t, J=6.6Hz), 5.35(2H, s), 6.89(1H, d, J=8.6Hz), 7.1-7.6(10H, m), 10.02(1H, s)
134	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	-OCH ₂ CO ₂ C(CH ₃) ₃	CDCl ₃ :1.53(9H, s), 2.64(2H, t, J=7.0Hz), 3.42(2H, t, J=7.0Hz), 4.48(2H, s), 5.47(2H, s), 6.71(1H, d, J=8.6Hz), 7.15-7.65(10H, m), 10.03(1H, s)
135	-H	-H	-Br	-H	-H	-H	CDCl ₃ :2.77 (2H, t, J = 7.4 Hz), 3.52 (2H, t, J = 7.5 Hz), 5.16 (2H, s), 7.03-7.14 (3H, m), 7.32 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.40-7.48 (2H, m), 7.50 (1H, dd, J = 0.8, 7.7 Hz), 10.20 (1H, s).
136	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	CDCl ₃ :2.70-2.82 (2H, m), 3.2 (2H, t, J=7.6 Hz), 5.17 (2H, s), 7.07 (1H, dd, J=1.0, 8.2 Hz), 7.10-7.20 (2H, m), 7.22-7.35 (3H, m), 7.49 (1H, d, J=1.1, 7.7 Hz), 10.20 (1H, s).

【0533】

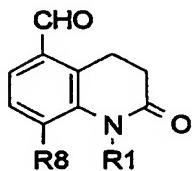
【表16】



参考例	R2	R3	R4	R5	R6	R8	1H-NMR	δ ppm
137	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	CDCl ₃ :2.31 (3H, s), 2.70-2.85 (2H, m), 3.51 (2H, t, J = 7.7 Hz), 5.17 (2H, s), 7.03-7.19 (5H, m), 7.20-7.36 (1H, m), 7.47 (1H, d, J = 7.6 Hz), 10.20 (1H, s).	
138	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	-CH ₃	CDCl ₃ :2.46 (3H, s), 2.54-2.60 (2H, m), 3.27-3.34 (2H, m), 5.13 (2H, s), 7.14 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.20-7.60 (9H, m), 10.13 (1H, s).	
139	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	-Cl	CDCl ₃ :2.58-2.64 (2H, m), 3.30-3.36 (2H, m), 5.44 (2H, s), 7.17 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.22-7.61 (9H, m), 10.12 (1H, s).	
140	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	-H	CDCl ₃ :2.78-2.84 (2H, m), 3.53-3.59 (2H, m), 5.30 (2H, s), 6.98 (1H, d, J=8.2Hz), 7.26-7.32 (1H, m), 7.38 (2H, d, J=8.8Hz), 7.53 (1H, d, J=6.7Hz), 8.20 (2H, d, J=8.8Hz), 10.22 (1H, s)	

【0534】

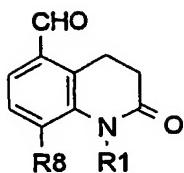
【表17】



参考例	R1	R8	1H-NMR	δ ppm
141	$-(\text{CH}_2)_4\text{OSi}(\text{CH}_3)_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	-H	CDCl ₃ :0.09(3H, s), 0.88(9H, s), 1.6-2.1(2H, m), 2.62(2H, t, J=7.2Hz), 3.42(2H, t, J=7.7Hz), 3.71(2H, t, J=5.7Hz), 4.06(2H, t, J=7.8Hz), 7.1-7.6(2H, m), 10.22(1H, s)	
142	-C ₆ H ₅	-H	CDCl ₃ :2.75-2.89 (2H, m), 3.53-3.68 (2H, m), 6.65 (1H, dd, J = 0.9, 8.2 Hz), 7.15-7.20 (3H, m), 7.39-7.61 (4H, m), 10.24 (1H, s).	
143	-H	-Cl	CDCl ₃ :2.61-2.72 (2H, m), 3.50-3.64 (2H, m), 7.40-7.51 (2H, m), 7.88 (1H, brs), 10.15 (1H, s).	

【0535】

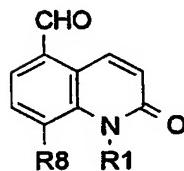
【表18】



参考例 R1	R8	1H-NMR δ ppm
144		-H CDCl3:1.05-1.9(9H, m), 1.51(9H, s), 2.6-2.8(4H, m), 3.35-3.50(2H, m), 3.95-4.2(2H, m), 7.23(1H, dd, J1=8.0Hz, J2=1.0Hz), 7.46(1H, t, J=8Hz), 7.54(1H, dd, J1=8.0Hz, J2=1.0Hz), 10.23(1H, s)
145		-H CDCl3:2.84 (2H, t, J = 7.5 Hz), 3.56 (2H, t, J = 7.5 Hz), 5.37 (2H, s), 7.13-7.21 (1H, m), 7.21-7.29 (1H, m), 7.29-7.40 (1H, m), 7.40-7.50 (3H, m), 7.61 (1H, s), 7.70-7.78 (1H, m), 7.78-7.87 (2H, m), 10.19 (1H, s).
146		-H CDCl3:2.74-2.80 (2H, m), 3.49-3.55 (2H, m), 5.21 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=8.1Hz), 7.26-7.38 (2H, m), 7.49-7.54 (2H, m), 8.33 (1H, d, J=2.5Hz), 10.20 (1H, s)

【0536】

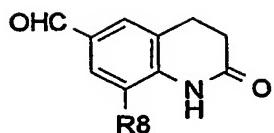
【表19】



参考例 R1	R8	1H-NMR δ ppm
147 -(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	-OCH ₃	CDCl3 : 0.99 (6H, d, J=6.2Hz), 1.5-1.8 (3H, m), 4.03 (3H, s), 4.57(2H, t, J=7.0Hz), 6.84 (1H, d, J=9.9Hz), 7.16 (1H, d, J=8.3Hz), 7.63 (1H, d, J=8.3Hz), 9.18(1H, d, J=9.9Hz), 10.09 (1H, s),
148	-OCH ₃	CDCl3:3.71 (3H, s), 5.77 (2H, brs), 6.89-7.00 (3H, m), 7.06 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, d, J = 8.4 Hz), 9.28 (1H, d, J = 9.9 Hz), 10.10 (1H, s).

【0537】

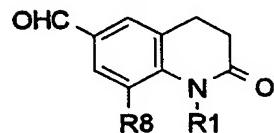
【表20】



参考例 R8		1H-NMR	δ ppm
149 -H	DMSO-d6:2.44-2.59 (2H, m), 2.96 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.00 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.65-7.78 (2H, m), 9.82 (1H, s), 10.50 (1H, brs).		
150 -CH ₃	CDCl ₃ :2.32 (3H, s), 2.65-2.72 (2H, m), 3.01-3.08 (2H, m), 7.54-7.65 (2H, m), 7.75 (1H, brs), 9.87 (1H, s).		
151 -OCH ₃	CDCl ₃ :2.65-2.72 (2H, m), 3.02-3.09 (2H, m), 3.95 (3H, m), 7.32 (2H, s), 7.94 (1H, brs), 9.86 (1H, s).		

【0538】

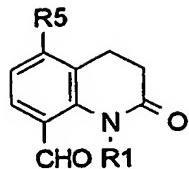
【表21】



参考例 R1	R8		1H-NMR	δ ppm
152	-H		DMSO-d6:2.68-2.81 (2H, m), 2.96-3.10 (2H, m), 5.17 (2H, s), 7.08 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.43-7.52 (2H, m), 7.68 (1H, dd, J = 1.9, 8.4 Hz), 7.76 (1H, d, J = 1.9 Hz), 9.84 (1H, s).	
153	-H		CDCl ₃ :2.82-2.93 (2H, m), 3.05-3.17 (2H, m), 5.31 (2H, s), 6.88 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.37 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.64 (1H, dd, J = 1.9, 8.4 Hz), 7.75 (1H, d, J = 1.9 Hz), 8.20 (2H, d, J = 8.7 Hz), 9.89 (1H, s).	
154	-OCH ₃		CDCl ₃ :2.67-2.74 (2H, m), 2.91-2.98 (2H, m), 3.83 (3H, s), 5.41 (2H, s), 7.18 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.23-7.35 (3H, m), 7.35-7.48 (4H, m), 7.48-7.57 (2H, m), 9.85 (1H, s).	
155	-CH ₃		CDCl ₃ :2.46 (3H, s), 2.62-2.68 (2H, m), 2.85-2.92 (2H, m), 5.20 (2H, s), 7.15 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.20-7.65 (9H, m), 9.88 (1H, s).	

【0539】

【表22】



参考例 R1	R5	1H-NMR δppm
156	-H	DMSO-d6: 2.55-2.68 (2H, m), 2.85-2.98 (2H, m), 5.07 (2H, s), 7.10 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.27-7.70 (10 H, m), 10.05 (1H, s).
157	-H	DMSO-d6: 7.51-7.62 (2H, m), 2.99 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.17 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.54 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.74 (1H, d, J = 7.5 Hz), 10.00 (1H, s), 10.31 (1H, brs).

【0540】

上記表において、Meはメチル基を、tBuはtert-ブチル基を、それぞれ意味する。

【0541】

実施例1

5-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イルメチル) チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

メトキシエタノール20mlに2-クロロ-3-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イル) プロピオン酸1.0g、チオ尿素0.45g及び酢酸ナトリウム0.4gを加えて110℃で7.5時間攪拌した。反応液を減圧下に濃縮し、残渣に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、析出した固体を濾取した。濾液をジクロロメタンで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣と濾物をあわせて10%塩酸とエタノールの混合溶媒に加え、一夜加熱還流した。溶媒を減圧下に留去し、残渣を含水DMFから再結晶して黄色粉末の5-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イルメチル) チアゾリジン-2, 4-ジオンを0.41g得た。

融点：254-255℃。

【0542】

実施例2

5-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イル) エチル] チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

メトキシエタノール20mlに2-クロロ-4-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イル) 酪酸912mg、チオ尿素390mg及び酢酸ナトリウム394mgを加えて110℃で4時間攪拌した。反応液を減圧下に濃縮し、残渣に水を加えてジクロロメタンで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残渣を10%塩酸10mlとエタノール10mlの混合溶媒に加え、一夜加熱還流した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をDMF-エタノール混合溶媒から再結晶して、黄色粉末の5-[2-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イル) エチル] チアゾリジン-2, 4-ジオンを332mg(収率31%)得た。

融点：222-224℃。

【0543】

実施例3

5-[3-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イル) プロピル] チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

メトキシエタノール 20m1 に 2-クロロ-5-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イル) 吉草酸 1g、チオ尿素 380mg 及び酢酸ナトリウム 380mg を加えて 110℃で 5 時間攪拌した。反応液を減圧下に濃縮し、残渣に水及び少量のエタノールを加えて析出した固体を濾取した。濾物を 10% 塩酸 10m1 とエタノール 10m1 の混合溶媒に加え、一夜加熱還流した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をジクロロメタンで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト（ジクロロメタン：メタノール = 100 : 1 → 10 : 1）で精製し、エタノール-エーテル混合溶媒から再結晶して淡黄色粉末の 5-[3-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イル) プロピル] チアゾリジン-2, 4-ジオンを 332mg (収率 29%) 得た。

融点：172-175℃。

【0544】

実施例4

5-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イル) チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

メトキシエタノール 50m1 に クロロ-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イル) 酢酸エチル 3.02g、チオ尿素 1.4g 及び酢酸ナトリウム 2g を加え、110℃で 2.5 時間攪拌した。反応液を減圧下に濃縮し、残渣に水を加え、析出した固体を濾取した。濾物を 10% 塩酸 30m1 とエタノール 30m1 の混合溶媒に加え、一夜加熱還流した。減圧下に半量になるまで濃縮し、水を加えて氷冷して析出した固体を濾取した。DMF-エタノール混合溶媒から再結晶して、灰色粉末の 5-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イル) チアゾリジン-2, 4-ジオンを 1.68g (収率 57%) 得た。

融点：255℃ (分解)。

【0545】

実施例5

5-[1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-4-イルメチリデン] チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-4-カルボキサルデヒド 1.50g 及び 2, 4-チアゾリジンジオン 0.826g をトルエン 30m1 に懸濁し、ピペリジン 5 滴及び酢酸 5 滴を加え、6 時間加熱還流した。放冷後、析出した固体を濾取乾燥して、薄茶かっ色粉末の 5-[1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-4-イルメチリデン] チアゾリジン-2, 4-ジオンを 1.01g (収率 50%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

5.53 (2H, s), 6.76 (1H, s), 7.11-7.49 (6H, m), 7.53-7.64 (1H, m), 7.81 (1H, d, J = 8.1 Hz), 8.04 (1H, s), 12.21-13.32 (1H, br)。

【0546】

実施例6

5-[1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-イルメチリデン] チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボキサルデヒド 1.50g 及び 2, 4-チアゾリジンジオン 0.826g をトルエン 30m1 に懸濁し、ピペリジン 5 滴及び酢酸 5 滴を加えて 6 時間加熱還流した。放冷後、析出した固体を濾取乾燥して、黄色粉末の 5-[1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-イルメチリデン] チアゾリジン-2, 4-ジオンを 1.36g (収率 68%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

5.55 (2H, s), 7.18-7.45 (6H, m), 7.53-7.65 (1H, m), 7.88-8.00 (2H, m), 8.21 (1H, s), 12.59 (1H, br s)。

【0547】

実施例6と同様にして、下記実施例7～13の化合物を製造した。

【0548】

実施例7

5-[1-(1-ビフェニル-4-イルメチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-4-イル)メチリデン]チアゾリジン-2,4-ジオン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

5.59 (2H, br s), 6.78 (1H, s), 7.18-7.70 (12H, m), 7.82 (1H, d, J=8.0Hz), 8.05 (1H, s), 12.81 (1H, br s)。

【0549】

実施例8

5-[1-(1-ビフェニル-4-イルメチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-3-イル)メチリデン]チアゾリジン-2,4-ジオン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

5.61 (2H, br s), 7.21-7.51 (7H, m), 7.51-7.68 (5H, m), 7.87-8.00 (2H, m), 8.22 (1H, s), 12.60 (1H, br s)。

【0550】

実施例9

5-[1-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)メチリデン]チアゾリジン-2,4-ジオン

融点：300℃以上

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

3.80 (3H, s), 3.95 (3H, s), 6.70 (1H, d, J=9.8Hz), 7.35-7.45 (2H, m), 8.05 (1H, d, J=9.8Hz), 8.14 (1H, s), 12.63 (1H, br s)。

【0551】

実施例10

5-[1-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル)メチリデン]-3-メチルチアゾリジン-2,4-ジオン

融点：270℃(分解)。

【0552】

実施例11

5-{1-[8-メトキシ-1-(4-プロモベンジル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-5-イル]メチル}チアゾリジン-2,4-ジオン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

3.65 (3H, s), 5.67 (2H, s), 6.80 (1H, d, J=9.8Hz), 7.03 (2H, d, J=8.5Hz), 7.25-7.40 (2H, m), 7.40-7.52 (2H, m), 8.16 (2H, d, J=10.9Hz), 12.64 (1H, br s)。

【0553】

実施例12

5-[1-(1-ビフェニル-4-イルメチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-7-イル)メチリデン]チアゾリジン-2,4-ジオン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 70-2. 84 (2H, m), 2. 97-3. 09 (2H, m), 5. 22 (2H, b r s), 7. 12 (1H, s), 7. 15-7. 25 (1H, m), 7. 25-7. 49 (6H, m), 7. 56-7. 71 (5H, m), 12. 52 (1H, b r s)。

【0554】

実施例13

5-[1-(1-ビフェニル-4-イルメチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-8-イル)メチリデン]チアゾリジン-2, 4-ジオン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 55-2. 68 (2H, m), 2. 80-2. 94 (2H, m), 4. 98 (2H, s), 6. 98-7. 16 (3H, m), 7. 22-7. 63 (9H, m), 7. 75 (1H, s), 12. 57 (1H, b r s)。

【0555】

実施例14

5-[1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-4-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-[1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-4-イルメチリデン]チアゾリジン-2, 4-ジオン 0. 96g、1, 4-ジヒドロ-2, 6-ジメチル-3, 5-ピリジンジカルボン酸ジエチル 0. 735g 及びシリカゲル 0. 96g をトルエン 30mL に加え、一夜加熱還流した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (ジクロロメタン:酢酸エチル=10:1→3:1) で精製した。クロロホルム、エーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の 5-[1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-4-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンを 0. 87g (収率 91%) 得た。

融点: 142. 1-143. 7°C。

【0556】

実施例15

5-[1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-[1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-イルメチリデン]チアゾリジン-2, 4-ジオン 1. 207g、1, 4-ジヒドロ-2, 6-ジメチル-3, 5-ピリジンジカルボン酸ジエチル 0. 924g 及びシリカゲル 1. 2g をトルエン 30mL に加え、一夜加熱還流した。さらに 1, 4-ジヒドロ-2, 6-ジメチル-3, 5-ピリジンジカルボン酸ジエチル 0. 77g を反応液に加え、一夜加熱還流した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (ジクロロメタン:酢酸エチル=10:1→3:1) で精製した。クロロホルム-エーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の 5-[1-(4-クロロベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-4-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンを 0. 74g (収率 61%) 得た。

融点: 230. 7-231. 9°C。

【0557】

実施例15と同様にして、下記実施例16~19の化合物を製造した。

【0558】

実施例16

5-(2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 45-2. 55 (1H, m), 3. 35-3. 5 (1H, m), 4. 9-5. 0 (1H, m), 7. 15-7. 7 (4H, m), 7. 84 (1H, s), 11. 91 (1H, b r s), 12. 08 (1H, b r s)。

【0559】

実施例17

5-(1-ビフェニル-4-イルメチル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオン
融点：220.4-221.8℃。

【0560】

実施例18

5-(1-ビフェニル-4-イルメチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-7-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオン
融点：213.2-213.7℃。

【0561】

実施例19

5-(1-ビフェニル-4-イルメチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-8-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2.40-2.53 (2H, m), 2.70-2.85 (2H, m), 3.09-3.25 (1H, m), 3.50-3.64 (1H, m), 4.79-4.90 (1H, m), 4.90-5.16 (2H, m), 7.02 (1H, t, J=7.5Hz), 7.08-7.21 (4H, m), 7.28-7.64 (7H, m), 12.04 (1H, s)。

【0562】

実施例20

5-[8-メトキシ-1-(4-ニトロベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-[8-メトキシ-1-(4-ニトロベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチリデン]チアゾリジン-2, 4-ジオン 600mg、1, 4-ジヒドロ-2, 6-ジメチル-3, 5-ピリジンジカルボン酸ジエチル 415mg 及びシリカゲル 600mg をトルエン 20ml に加え、14時間加熱還流した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン:酢酸エチル=4:1→1:1) で精製した。酢酸エチル-エーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の 5-[8-メトキシ-1-(4-ニトロベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンを 585mg (収率 97%) 得た。

融点：246.5-246.6℃。

【0563】

実施例21

5-[1-(4-アミノベンジル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-[8-メトキシ-1-(4-ニトロベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオン 10.0g の DMF 溶液 (100ml) に 10% パラジウム炭素 10g を加え、40℃で 5 時間接触還元した。触媒を濾過して除き、濾液を濃縮した。残渣に酢酸エチルと水を加えてセライト濾過し、濾液を水洗し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をシリカゲルクロマト (n-ヘキサン:酢酸エチル=4:1→1:4) で精製した。酢酸エチルから再結晶して、白色粉末の 5-[1-(4-アミノベンジル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンを 7.98g (収率 86%) 得た。

融点：174.1-174.8℃。

【0564】

実施例22

5-[8-メトキシ-1-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-[1-(4-アミノベンジル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオン 0.7 g 及び2-ナフト酸 0.59 g の DMF 溶液 (14 ml) に、氷冷下トリエチルアミン 0.52 g 及びジエチルホスホシアニデート (DEPC) 0.42 g を加えて 16 時間攪拌した。反応液に水及び酢酸エチルを加え、生成した不溶物を濾取した。濾物をジクロロメタン-メタノール混合溶媒に溶解後、濃縮し、残渣をジエチルエーテルエーテル及びジイソプロピルエーテルで洗浄した。減圧下に乾燥して白色無定形固体の 5-[8-メトキシ-1-[4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジル]-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンを 0.74 g (収率 77%) 得た。

融点：202-208°C

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2.44-2.52 (2H, m), 2.82-2.88 (2H, m), 3.03-3.13 (1H, m), 3.35-3.45 (1H, m), 3.73 (3H, s), 4.79 (1H, dd, J₁=4.1 Hz, J₂=9.9 Hz), 5.20 (2H, s), 6.83 (1H, d, J=8.6 Hz), 6.91 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.05 (2H, d, J=8.4 Hz), 7.58-7.66 (4H, m), 7.95-8.08 (4H, m), 8.52 (1H, s), 10.33 (1H, s), 12.06 (1H, s)。

【0565】

実施例 23

5-[1-(4-ペンチルオキシカルボニルアミノベンジル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-[1-(4-アミノベンジル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオン 0.6 g のジクロロメタン (6 ml) に懸濁し、氷冷下ピリジン 4 ml を加え溶液とした。これにクロロ蟻酸アミル 0.26 g を加えて 1 時間攪拌した。反応液に 1 N 塩酸を加え、酢酸エチルで抽出した。水で 2 回、飽和食塩水で 1 回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン：酢酸エチル = 2:1 → 1:1) で精製し、ジイソプロピルエーテルから再結晶して、白色粉末の 5-[1-(4-ペンチルオキシカルボニルアミノベンジル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンを 3.75 g (収率 97%) 得た。

融点：98-102°C。

【0566】

実施例 24

5-[8-メトキシ-1-(4-メトキシカルボニルベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチリデン]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

8-メトキシ-1-(4-メトキシカルボニルベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド 7.0 g 及び 2, 4-チアゾリジンジオン 3.25 g をトルエン 70 ml に懸濁し、ピペリジン 10 滴及び酢酸 10 滴を加えて 4 時間加熱還流した。放冷後、析出した固体を濾取乾燥して、淡黄色粉末の 5-[8-メトキシ-1-(4-メトキシカルボニルベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチリデン]チアゾリジン-2, 4-ジオンを 8.0 g (収率 90%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2.52-2.66 (2H, m), 2.91-3.05 (2H, m), 3.65 (3H, s), 3.79 (3H, s), 5.17 (2H, s), 7.02 (1H, d, J=8.7 Hz), 7.16 (1H, d, J=8.7 Hz), 7.25 (2H, d, J=8.3 Hz)

) , 7. 74-7. 90 (3H, m) , 12. 55 (1H, br s) 。

【0567】

実施例25

5-[8-メトキシ-1-(4-メトキシカルボニルベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成
 5-[8-メトキシ-1-(4-メトキシカルボニルベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチリデン]チアゾリジン-2, 4-ジオン
 7. 0 g の DMF 溶液 (70 ml) に 10% パラジウム炭素 7. 0 g を加え、40°C で 5 時間接触還元した。触媒を濾過して除き、濾液を濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン: 酢酸エチル = 4:1 → 1:1) で精製した。酢酸エチル-ジエチルエーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の 5-[8-メトキシ-1-(4-メトキシカルボニルベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンを 5. 23 g (収率 74%) 得た。
 融点: 193. 1-195. 5°C。

【0568】

実施例26

5-[8-メトキシ-1-(4-カルボキシベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成
 5-[8-メトキシ-1-(4-メトキシカルボニルベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオン 4. 0 g のエタノール (200 ml) 及び THF (200 ml) 混合溶液に、1N-水酸化リチウム水溶液 35 ml を加え、室温で一夜攪拌した。溶媒を減圧下に留去し、残渣に塩酸を加え、生成した不溶物を濾取した。シリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン: 酢酸エチル = 1:1 → 1:3) で精製し、酢酸エチルから再結晶して、白色粉末の 5-[8-メトキシ-1-(4-カルボキシベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンを 3. 75 g (収率 97%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 42-2. 61 (2H, m) , 2. 70-2. 94 (2H, m) , 3. 01-3. 15 (1H, m) , 3. 34-3. 48 (1H, m) , 3. 56 (3H, s) , 4. 78 (1H, dd, J = 4. 4, 9. 8 Hz) , 5. 17 (2H, br s) , 6. 81 (1H, d, J = 8. 6 Hz) , 6. 90 (1H, d, J = 8. 6 Hz) , 7. 17 (2H, d, J = 8. 2 Hz) , 7. 77 (2H, d, J = 8. 2 Hz) , 12. 06 (1H, br s) , 12. 76 (1H, br s) 。

【0569】

実施例27

5-[1-[4-(4-イソプロピルフェニルアミノカルボニル)ベンジル]-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-[8-メトキシ-1-(4-カルボキシベンジル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオン 0. 5 g 及び 4-イソプロピルアニリン 0. 23 g の DMF 溶液 (10 ml) に、氷冷下トリエチルアミン 0. 34 g 及びジエチルホスホシアニデート (DEPC) 0. 28 g を加え、0. 5 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で 2 回洗浄し、飽和食塩水で 1 回洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (ジクロロメタン: メタノール = 100:1 → 20:1) で精製し、酢酸エチル-n-ヘキサン混合溶媒から再結晶して、白色粉末の 5-[1-[4-(4-イソプロピルフェニルアミノカルボニル)ベンジル]-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンを 0. 57 g (収率 64%) 得た。

融点：243—244℃。

【0570】

実施例27と同様にして、下記実施例28～29の化合物を製造した。

【0571】

実施例28

5-[8-メトキシ-1-[4-(ピペリジン-1-カルボニル)ベンジル]-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 25—1. 80 (6H, m), 2. 39—2. 62 (2H, m), 2. 72—2. 95 (2H, m), 2. 95—3. 72 (9H, m), 4. 77 (1H, dd, J=4. 3, 9. 6 Hz), 5. 16 (2H, s), 6. 81 (1H, d, J=8. 6 Hz), 6. 90 (1H, d, J=8. 6 Hz), 7. 09 (2H, d, J=8. 0 Hz), 7. 18 (2H, d, J=8. 0 Hz), 12. 05 (1H, br s)。

【0572】

実施例29

5-[1-(4-シクロヘキシルアミノカルボニルベンジル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

0. 95—1. 85 (10H, m), 2. 39—2. 60 (2H, m), 2. 70—2. 94 (2H, m), 3. 00—3. 19 (1H, m), 3. 23—3. 50 (1H, m), 3. 63 (3H, s), 3. 80—3. 99 (1H, m), 4. 64—4. 88 (1H, m), 5. 19 (2H, s), 6. 80 (1H, d, J=8. 6 Hz), 6. 89 (1H, d, J=8. 6 Hz), 7. 11 (2H, J=8. 0 Hz), 7. 65 (2H, d, J=8. 0 Hz), 8. 03 (1H, d, J=7. 8 Hz), 12. 06 (1H, br s)。

【0573】

実施例30

5-(1-ベンジル-8-ヒドロキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチリデン)チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

1-ベンジル-8-ヒドロキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド2. 0 g及び2, 4-チアゾリジンジオン0. 874 gをトルエン20mlに懸濁し、ピペリジン10滴及び酢酸10滴を加え、8時間加熱還流した。放冷後、析出した固体を濾取乾燥して、黄色粉末の5-(1-ベンジル-8-ヒドロキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチリデン)チアゾリジン-2, 4-ジオンを2. 7 g (収率92%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2. 41—2. 60 (2H, m), 2. 75—2. 98 (2H, m), 5. 31 (2H, s), 6. 84 (1H, d, J=8. 6 Hz), 7. 00—7. 30 (6H, m), 7. 81 (1H, s), 10. 72 (1H, s), 12. 48 (1H, br s)。

【0574】

実施例31

5-(1-ベンジル-8-ヒドロキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-(1-ベンジル-8-ヒドロキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチリデン)チアゾリジン-2, 4-ジオン2. 2 gのDMF溶液(20ml)に、10%パラジウム炭素2. 2 gを加え、室温で2時間接触還元した。触媒を濾過して除き、濾液を濃縮した。残渣を酢酸エチルに溶解し、水及び飽和食塩水で洗浄後濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト(ジクロロメタン:メタノール=50:1)

で精製した。ジクロロメタン-エーテル混合溶媒から再結晶して、白色粉末の5-(1-ベンジル-8-ヒドロキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンを1.9g(収率88%)得た。

融点：213.2-313.7℃。

【0575】

実施例32

5-(1-ベンジル-8-ブトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-(1-ベンジル-8-ヒドロキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオン90mgのDMSO溶液(1mL)にカリウム-tert-ブトキシド55.5mgを加え、室温で1時間攪拌した。これに4-ヨートブタン29.8μlを加えて室温で2時間攪拌した。反応液に水を加え、硫酸水素カリウムを加えて酢酸エチルで抽出した。水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し濃縮した。残渣をプレパラティブシリカゲル薄層クロマト(ジクロロメタン：メタノール=20:1)で精製して、無色無定形固体の5-(1-ベンジル-8-ブトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンを42mg(収率41%)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

0.93(3H, t, J=7.3Hz), 1.35-1.50(2H, m), 1.57-1.73(2H, m), 2.52-2.67(2H, m), 2.67-2.95(2H, m), 3.05(1H, dd, J=10.1Hz, J=14.0Hz), 3.51(1H, dd, J=4.0Hz, J=14.0Hz), 3.89(2H, t, J=6.6Hz), 4.39(1H, dd, J=4.0Hz, J=10.1Hz), 5.32(2H, s), 6.71(1H, d, J=8.6Hz), 6.87(1H, d, J=8.6Hz), 7.02-7.25(5H, m), 9.15(1H, brs)。

【0576】

実施例33

5-(1-ベンジル-8-ベンジルオキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-(1-ベンジル-8-ヒドロキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオン90mgのDMSO溶液(1mL)に、カリウム-tert-ブトキシド55.5mgを加え、室温で1時間攪拌した。これに臭化ベンジル30μlを加え、室温で1時間攪拌した。反応液に水を加え、硫酸水素カリウムを加え、酢酸エチルで抽出した。水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮した。残渣をプレパラティブシリカゲル薄層クロマト(ジクロロメタン：メタノール=20:1)で精製して、無色無定形固体の5-(1-ベンジル-8-ベンジルオキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンを84.5mg(収率76%)得た。

¹H-NMR(CDC13) δ ppm:

2.49-2.65(2H, m), 2.65-2.94(2H, m), 3.07(1H, dd, J=10.0Hz, J=14.5Hz), 3.51(1H, dd, J=4.1Hz, J=14.5Hz), 4.39(1H, dd, J=4.1Hz, J=10.0Hz), 4.97(2H, s), 5.32(2H, s), 6.76(1H, d, J=8.6Hz), 6.86(1H, d, J=8.6Hz), 6.93-7.02(2H, m), 7.03-7.19(3H, m), 7.29-7.45(5H, m), 9.07(1H, brs)。

【0577】

実施例34

5-(1-カルボキシメチル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

1-tert-ブトキシカルボニルメチル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド 4. 16 g 及び 2, 4-チアゾリジンジオン 1. 66 g (1. 00 当量) をトルエン 40 ml に懸濁し、酢酸及びピペリジンを二滴ずつ加え、ディーンスタークを用いて 13 時間加熱還流した。冷却して結晶を濾別し、トルエンで洗浄した。得られる結晶をシリカゲル 3. 15 g、ジヒドロピリジン 2. 09 g 及びトルエン 60 ml に懸濁し、終夜で加熱還流した。シリカゲルを 3. 15 g 加え、減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) で精製し、酢酸エチル-ヘキサンで再結晶して白色粉末の 5-(1-カルボキシメチル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル) チアゾリジン-2, 4-ジオンを 2. 13 g 得た (収率 38 %)。

融点：251-255°C。

【0578】

実施例 35

5-(1-[N-(3-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]カルボニルメチル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオン カリウム塩の合成

5-(1-カルボキシメチル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオン 500 mg を DMF 5 ml に溶かし、3-トリフルオロメチルアニリン 0. 35 ml、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (WSC) 0. 32 g 及び 1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (HOB T) 0. 25 g を加え、室温で終夜攪拌した。反応液に水を加え、生じた固体を濾別した。固体を塩化メチレンに溶かし、食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (メチレンクロリド : メタノール = 50 : 1) で精製し、5-(1-[N-(3-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]カルボニルメチル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンを 412 mg 得た。

【0579】

斯くして得られる 5-(1-[N-(3-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]カルボニルメチル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンを THF 4 ml に溶かし、t-ブトキシカリウム 84. 5 mg 加え、固体を溶解させた。ジエチルエーテルを加え、トリチレーションを行い、生じた結晶を濾別し、乾燥させ、5-(1-[N-(3-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]カルボニルメチル-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオン・カリウム塩を褐色粉末として 340 mg (収率 49%) 得た。

融点：135-139. 5°C。

【0580】

実施例 36

5-(8-メトキシ-1-ピペリジン-4-イルメチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-[8-メトキシ-1-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イルメチル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオン 1. 7 g を 4 N-塩化水素酢酸エチル溶液 50 ml に加え、室温で 6 時間攪拌した。減圧下に濃縮し、残渣に炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて生成した不溶物を濾取し、乾燥して、白色粉末の 5-(8-メトキシ-1-ピペリジン-4-イルメチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンを 1. 5 g (収率定量的) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm :

1. 05-1. 3 (2H, m), 1. 4-1. 7 (3H, m), 2. 3-2. 9 (6H,

m) , 3. 0 - 3. 25 (3H, m) , 3. 82 (3H, s) , 4. 00 (2H, d, J = 6. 8 Hz) , 4. 63 (1H, dd, J = 8. 7 Hz, J = 4. 2 Hz) , 6. 9 - 7. 05 (2H, m) 。

【0581】

実施例37

5-[1-[2-[1-(4-メチルベンゾイル)ピペリジン-4-イル]エチル]-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-[1-[2-(1-ピペリジン-4-イル)エチル]-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル]チアゾリジン-2, 4-ジオン 100 mg、p-トルイル酸 42. 2 mg、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (WSC) 59. 4 mg 及び 1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (HO Bt) 43. 5 mg に DMF 2 ml を加え、室温で 2 時間 30 分攪拌した。水を加え、しばらく攪拌し、生じた固体を濾取した。固体をメチレンクロリドに溶かし、シリカゲルクロマトグラフィー (メチレンクロリド:メタノール = 20 : 1) で精製して、表題の化合物 68. 4 mg を白色固体として得た (収率 97 %)。

融点：60 - 65°C。

【0582】

実施例38

5-[1-(5-ベンジル-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナトリジン-2-イル)メチリデン]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-ベンジル-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナントリジン-2-カルボキサルデヒド 592 mg 及び 2, 4-チアゾリジンジオン 221 mg をトルエン 10 ml に懸濁させ、酢酸及びピペリジンを 2 滴ずつ加え、一夜加熱還流した。反応液を冷却し、生じた固体を濾取し、トルエン-ジエチルエーテルで洗浄後、乾燥し、5-[1-(5-ベンジル-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナトリジン-2-イル)メチリデン]チアゾリジン-2, 4-ジオンを黄色固体として 620 mg 得た (収率 80 %)。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

5. 67 (2H, s) , 7. 0 - 8. 0 (10H, m) , 8. 45 (1H, dd, J = 8. 0 Hz, 1. 3 Hz) , 8. 60 (1H, d, J = 8. 0 Hz) , 8. 80 (1H, d, J = 1. 8 Hz) , 12. 6 (1H, brs) 。

【0583】

実施例39

5-[1-(5-ベンジル-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナトリジン-2-イル)メチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-[1-(5-ベンジル-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナトリジン-2-イル)メチリデン]チアゾリジン-2, 4-ジオン 620 mg を THF 2. 31 ml に溶かし、ピリジン 2. 31 ml 及び 2 M 水素化ホウ素リチウム THF 溶液 2. 31 ml を加え、4 時間加熱還流した。反応液を冷却し、希塩酸で酸性にし、ジクロロメタンで抽出した。有機層を水洗し、飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。濾過後、溶媒を減圧下留去し、ジクロロメタンを用い結晶化させ、生じた固体を濾別した。これを風乾して、5-[1-(5-ベンジル-6-オキソ-5, 6-ジヒドロフェナトリジン-2-イル)メチル]チアゾリジン-2, 4-ジオンを 232 mg 白色結晶として得た (収率 36 %)

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

3. 1 - 3. 7 (2H, m) , 5. 04 (1H, dd, J = 13. 8 Hz, J = 4. 8 Hz) , 5. 76 (2H, s) , 7. 1 - 7. 45 (5H, m) , 7. 6 - 8. 0 (2H, m) , 8. 3 - 8. 6 (3H, m) , 12. 0 (1H, brs) 。

【0584】

実施例40

5- {8-メトキシ-1-[1-(2-メチルベンジル)ピペリジン-4-イル]メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル} チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5- (8-メトキシ-1-ピペリジン-4-イルメチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル) チアゾリジン-2, 4-ジオン ($20\ \mu\text{mol}$, 1. 0当量) に、2-メチルベンズアルデヒド ($24\ \mu\text{mol}$ 、1. 2当量) 及び酢酸 ($10\ \mu\text{l}$) のDMF ($200\ \mu\text{l}$) 溶液を加え、さらにS i-シアノ水素化ホウ素ナトリウムを加えた。この溶液を数分間振動した後、ジイソプロピルエチルアミン ($30\ \mu\text{l}$) を加え、室温で終夜反応を行った。樹脂を濾過で除き、ジクロロメタンで洗浄した。窒素気流で滤液の溶媒を留去し、残渣をH P L C (UV-トリガー、カラム：CAPCELL PAK C18, UG 120 S-5, $20\text{ mm} \times 50\text{ mm}$ 、0. 05%トリフロオロ酢酸-H₂O, 0. 05%トリフロオロ酢酸-CH₃CN) で精製した。LC-MSで構造を確認し、凍結乾燥を行った。50. 5%の収率で、5- {8-メトキシ-1-[1-(2-メチルベンジル)ピペリジン-4-イル]メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル} チアゾリジン-2, 4-ジオンを得た。

MS : 508 (M⁺¹)。

【0585】

実施例4 1

5- {8-メトキシ-1-[1-(テトラヒドロピラン-4-イル)ピペリジン-4-イル]メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル} チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5- (8-メトキシ-1-ピペリジン-4-イルメチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル) チアゾリジン-2, 4-ジオン ($20\ \mu\text{mol}$, 1. 0当量) に、テトラヒドロピラン-4-オノン ($24\ \mu\text{mol}$ 、1. 2当量) 及び酢酸 ($10\ \mu\text{l}$) のDMF ($200\ \mu\text{l}$) 溶液を加え、さらにMP-トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムを加えた。この溶液を数分間振動した後、D I E A ($30\ \mu\text{l}$) を加え、60℃で終夜反応を行った。樹脂を濾過で除き、塩化メチレンで洗浄した。窒素ガスで溶媒を留去し、残渣をH P L C (UV-トリガー、カラム：CAPCELL PAK C18, UG 120 S-5, $20\text{ mm} \times 50\text{ mm}$ 、0. 05%トリフロオロ酢酸-H₂O, 0. 05%トリフロオロ酢酸-CH₃CN) で精製した。LC-MSで構造を確認し、凍結乾燥を行った。30%の収率で、5- {8-メトキシ-1-[1-(テトラヒドロピラン-4-イル)ピペリジン-4-イル]メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル} チアゾリジン-2, 4-ジオンを得た。

MS : 488 (M⁺¹)。

【0586】

実施例4 2

5- [1-(4-メタンスルホニルアミノベンジル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル] チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5- [1-(4-アミノベンジル)-8-メトキシ-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-イルメチル] チアゾリジン-2, 4-ジオン 1.00 g (0. 00243ミリモル) のジクロロメタン (20 ml) 溶液に、氷冷攪拌下、ピリジン (2.0 ml) 及びメタンスルホニルクロリド 0.21 ml (0. 0027ミリモル) を順次加えた。同温下で30分攪拌後、水を加えて反応を停止し、水洗 (水×2, 飽和食塩水×1)、乾燥 (硫酸マグネシウム)、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト (ジクロロメタン: 酢酸エチル=1:10→1:1) にて精製し、白色不定形固体の標記化合物 1.1 g を得た (92%)。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm :

2.39-2.54 (2H, m), 2.72-2.87 (2H, m), 2.88 (3H, s), 3.05 (1H, dd, J=10.0Hz, J=14.4Hz), 3.39 (1H

, d d, J = 4. 0 Hz, J = 14. 4 Hz), 3. 67 (3 H, s), 4. 76 (1 H, d d, J = 4. 0 Hz, J = 10. 0 Hz), 5. 13 (2 H, s), 6. 80 (1 H, d, J = 8. 6 Hz), 6. 89 (1 H, d, J = 8. 6 Hz), 6. 93-7. 06 (4 H, m), 9. 57 (1 H, s), 12. 05 (1 H, s)。

【0587】

実施例43

3-メトキシカルボニルメチル-5-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオンの合成

5-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオン 350 mg を DMF 5 ml に溶かし、メチルプロモアセテート 0. 156 ml 及び炭酸カリウム 0. 25 g 加え、室温で終夜攪拌した。水を加え、メチレンクロリドで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。濾過後、溶媒を減圧下留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、更にメタノール-アセトンで再結晶することにより、3-メトキシカルボニルメチル-5-(8-メトキシ-1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-5-イルメチル)チアゾリジン-2, 4-ジオン 245 mg を白色結晶として得た (収率 57 %)。

融点：182-184℃。

【0588】

実施例44

1-ビフェニル-4-イルメチル-5-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-5-イリデンメチル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

1-ビフェニル-4-イルメチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-5-カルボキサルデヒド 1. 50 g 及び 2, 4-チアゾリジンジオン 0. 761 g をトルエン 20 ml に懸濁し、ピペリジン 2 滴及び酢酸 2 滴を加え、4 時間加熱還流した。放冷後、析出した固体を濾取し、乾燥して、黄色粉末の 1-ビフェニル-4-イルメチル-5-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-5-イリデンメチル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを 2. 34 g (収率 91%) 得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm :

2. 76-2. 81 (2 H, m), 3. 04-3. 09 (2 H, m), 5. 23 (2 H, m), 7. 10-7. 47 (8 H, m), 7. 54 (1 H, s), 7. 59-7. 65 (4 H, m), 13. 78 (1 H, br s)。

【0589】

実施例44と同様にして、下記実施例45の化合物を製造した。

【0590】

実施例45

1-(4-プロモベンジル)-5-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-5-イリデンメチル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm :

2. 67-2. 80 (2 H, m), 2. 93-3. 09 (2 H, m), 5. 14 (2 H, s), 7. 04 (1 H, d, J = 8. 6 Hz), 7. 10-7. 25 (2 H, m), 7. 32-7. 57 (5 H, m), 13. 77 (1 H, br s)。

【0591】

実施例46

1-ビフェニル-4-イルメチル-5-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-5-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

1-ビフェニル-4-イルメチル-5-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-5-イリデンメチル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン 1. 4 g, 1, 4-ジヒドロ-2, 6-ジメチル-3, 5-ピリジンジカルボン酸ジエチル 1. 01 g 及びシリカゲル 1. 4 g をトルエン 20 ml に加え、一夜加熱還流した。溶媒を留去し、残渣を

シリカゲルカラムクロマト（n-ヘキサン：酢酸エチル=4：1→2：1）で精製した。精製物をトルエンから再結晶して、白色粉末の1-ビフェニル-4-イルメチル-5-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-5-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを0.84g（収率60%）得た。

融点：186.3-187.1。

【0592】

実施例47

1-(4-プロモベンジル)-5-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-5-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンの合成

1-(4-プロモベンジル)-5-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-5-イリデンメチル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン50mgをメタノール0.15ml、水0.1ml、1N-水酸化ナトリウム水溶液0.08ml及びTHF0.1mlの混合溶媒に懸濁し、これに塩化コバルト6水和物42mg及びジメチルグリオキシム250mgのDMF(5ml)溶液を0.03ml加え、30~40℃に加熱した。水素化ホウ素ナトリウム15mgの水溶液(0.1ml)を加え、30分攪拌した。飽和硫酸水素カリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮し、残渣をプレパラティブシリカゲル薄層クロマト(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:1)で精製して、無色無定形固体の1-(4-プロモベンジル)-5-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-5-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オンを44.7mg(収率89%)得た。さらに、酢酸エチル-ジエチルエーテルから再結晶して白色粉末を得た。

融点：191.3-192.1℃。

【0593】

実施例47と同様にして、下記実施例48の化合物を製造した。

【0594】

実施例48

1-(6-クロロピリジン-3-イルメチル)-5-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-5-イルメチル)-3, 4-ジヒドロ-1H-キノリン-2-オン・塩酸塩

融点：70-80℃。

【0595】

実施例6と同様にして、下記実施例49~110の化合物を合成した。

【0596】

実施例15と同様にして、実施例111~119、121~131、134~138、140~144、148、150~153、156~159、161~165、173、177~182、184~188、859~860、965~969、975~976及び986~1001の化合物を合成した。

【0597】

実施例21と同様にして、下記実施例120及び133の化合物を合成した。

【0598】

実施例22と同様にして、下記実施例189~225及び259~291の化合物を合成した。

【0599】

実施例23と同様にして、下記実施例228~257、292~309、656~658、664、666~667、681~686及び690~694の化合物を合成した。

【0600】

実施例27と同様にして、下記実施例176及び310~545の化合物を合成した。

【0601】

実施例32と同様にして、下記実施例546~606の化合物を合成した。

【0602】

実施例35と同様にして、下記実施例607~613、614~655、659~666

3、665、668～680及び687～689の化合物を合成した。

【0603】

実施例38と同様にして、下記実施例695～699及び921～959の化合物を合成した。

【0604】

実施例39と同様にして、下記実施例139、145～147、154～155、166～172、174～175、700～704、913～920、960～964、970～972及び977～985の化合物を合成した。

【0605】

実施例40と同様にして、下記実施例705～759の化合物を合成した。

【0606】

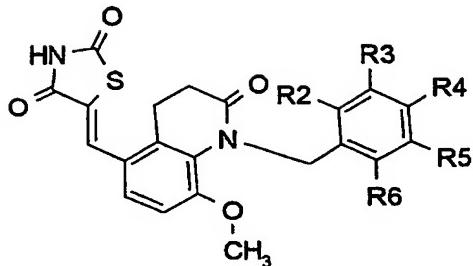
実施例42と同様にして、下記実施例760～855の化合物を合成した。

【0607】

実施例43と同様にして、下記実施例857及び861～912の化合物を合成した。

【0608】

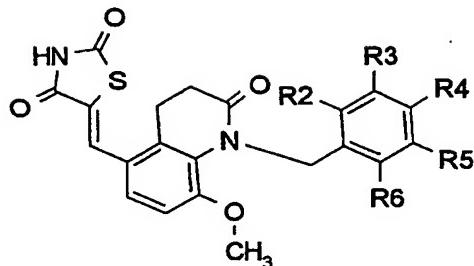
【表23】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
49	-H	-H	-H	-H	-H	2.55(2H, t, J=6.9Hz), 2.93(2H, t, J=6.9Hz), 3.76(3H, s), 5.21(2H, s), 7.0-7.25(7H, m), 7.83(1H, s), 12.56(1H, br s)
50	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	2.57(2H, t, J=6.9Hz), 2.97(2H, t, J=6.9Hz), 3.80(3H, s), 5.25(2H, s), 7.0-7.65(11H, m), 7.85(1H, s), 13.1(1H, br s)
51	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	1.20(9H, s), 2.54(2H, t, J=6.9Hz), 2.93(2H, t, J=6.9Hz), 3.81(3H, s), 5.20(2H, s), 7.00(2H, d, J=8.2Hz), 7.08(1H, d, J=8.8Hz), 7.17(1H, d, J=8.8Hz), 7.22(2H, d, J=8.2Hz), 7.84(1H, s), 12.5(1H, br s)
52	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	2.58(2H, t, J=6.9Hz), 2.96(2H, t, J=6.9Hz), 3.77(3H, s), 5.77(2H, s), 6.8-7.65(11H, m), 7.86(1H, s), 12.7(1H, br s)
53	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	2.50(2H, t, J=6.9Hz), 2.78(2H, t, J=6.9Hz), 3.36(3H, s), 5.20(2H, s), 6.90(1H, d, J=8.6Hz), 7.1-7.6(10H, m), 7.81(1H, s), 12.6(1H, br s)
54	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	2.55-2.69 (2H, m), 2.95-3.10 (2H, m), 3.60 (3H, s), 5.15 (2H, s), 7.05 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.19 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.40 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.85 (1H, s), 8.11 (2H, d, J = 8.8 Hz), 12.56 (1H, brs).
55	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	2.52-2.66 (2H, m), 2.91-3.05 (2H, m), 3.65 (3H, s), 3.79 (3H, s), 5.17 (2H, s), 7.02 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.16 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.25 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.74-7.90 (3H, m), 12.55 (1H, brs).

【0609】

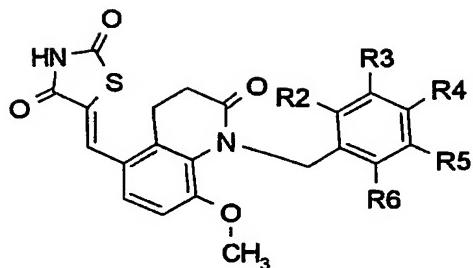
【表24】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
56	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	2.40-2.62 (2H, m), 2.80-3.00 (2H, m), 3.64 (3H, s), 3.81 (3H, s), 5.16 (2H, s), 6.69-6.82 (2H, m), 6.95-7.10 (3H, m), 7.10-7.13 (1H, m), 7.81 (1H, s), 12.54 (1H, brs).
57	-H	-H	-Cl	-H	-H	2.45-2.65 (2H, m), 2.85-3.04 (2H, m), 3.72 (3H, s), 5.12 (2H, s), 7.03 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.06-7.31 (5H, m), 7.82 (1H, s), 12.53 (1H, brs).
58	-H	-H	-Br	-H	-H	2.42-2.65 (2H, m), 2.85-3.04 (2H, m), 3.72 (3H, s), 5.11 (2H, s), 6.96-7.12 (3H, m), 7.16 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.39 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.83 (1H, s), 12.54 (1H, brs).
59	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	2.42-2.61 (2H, m), 2.81-2.99 (2H, m), 3.80 (3H, s), 4.97 (2H, s), 5.16 (2H, s), 6.82 (2H, d, J = 8.7 Hz), 6.95-7.10 (3H, m), 7.15 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.22-7.43 (5H, m), 7.81 (1H, s), 12.50 (1H, brs).
60	-H	-H	-F	-H	-H	2.85-3.05 (2H, m), 3.28-3.42 (2H, m), 4.19 (3H, s), 5.60 (2H, s), 7.36-7.52 (3H, m), 7.52-7.70 (3H, m), 8.21 (1H, s), 12.40-13.45 (1H, br).
61	-H	-H	-CN	-H	-H	2.50-2.66 (2H, m), 2.90-3.06 (2H, m), 3.61 (3H, s), 5.12 (2H, s), 7.04 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.18 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.32 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.70 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.85 (1H, s), 12.56 (1H, s).

【0610】

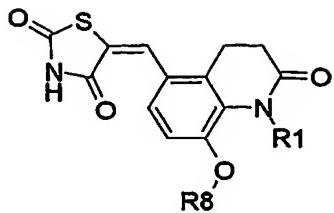
【表25】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	¹ H NMR (DMSO-d ₆) δ ppm
62	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	2.17 (3H, s), 2.42-2.62 (2H, m), 2.76-3.00 (2H, m), 3.79 (3H, s), 5.18 (2H, s), 6.88-7.08 (5H, m), 7.14 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.82 (1H, s), 12.54 (1H, s).
63	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	2.50-2.64 (2H, m), 2.87-3.02 (2H, m), 3.78 (3H, s), 5.18 (2H, s), 6.84 (2H, d, J = 8.6 Hz), 6.90-6.93 (2H, m), 7.03-7.11 (4H, m), 7.18 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.32-7.37 (2H, m), 7.84 (1H, s), 12.59 (1H, brs).

【0611】

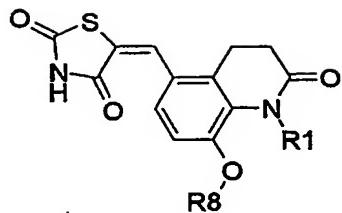
【表26】



実施例	R1	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
64	-CH ₃	-CH ₃	2.44(2H, t, J=6.9Hz), 2.90(2H, t, J=6.9Hz), 3.21(3H, s), 3.89(3H, s), 7.17(1H, d, J=8.8Hz), 7.23(1H, d, J=8.8Hz), 7.86(1H, s), 12.59(1H, br s)
65	-H	-CH ₃	2.47(2H, t, J=6.9Hz), 2.99(2H, t, J=6.9Hz), 3.89(3H, s), 7.05-7.2(2H, m), 7.86(1H, s)
66	-C ₄ H ₉	-CH ₃	0.81(3H, t, J=7.3Hz), 1.1-1.2(2H, m), 1.3-1.4(2H, m), 2.43(2H, t, J=6.9Hz), 2.87(2H, t, J=6.9Hz), 3.89(3H, s), 3.92(2H, t, J=7.3Hz), 7.17(1H, d, J=8.8Hz), 7.24(1H, d, J=8.8Hz), 7.86(1H, s), 12.57(1H, br s)
67	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	-CH ₃	1.65-1.8(2H, m), 2.35-2.5(4H, m), 2.89(2H, t, J=6.9Hz), 3.78(3H, s), 3.92(2H, t, J=7.3Hz), 7.0-7.3(7H, m), 7.86(1H, s), 12.25(1H, br s)
68	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	2.35(2H, t, J=6.9Hz), 2.55(2H, t, J=4.5Hz), 2.73(2H, t, J=6.9Hz), 3.96(3H, s), 4.16(2H, t, J=4.5Hz), 6.99(1H, d, J=8.8Hz), 7.1-7.3(5H, m), 7.79(1H, s), 12.59(1H, br s)
69	-C ₂ H ₅	-CH ₃	1.07(3H, t, J=7.0Hz), 2.42(2H, t, J=6.9Hz), 2.87(2H, t, J=6.9Hz), 3.85(2H, q, J=7.0Hz), 3.90(3H, s), 7.18(1H, d, J=8.8Hz), 7.24(1H, d, J=8.8Hz), 7.86(1H, s), 12.59(1H, br s)
70	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	-CH ₃	0.05-0.10(2H, m), 0.25-0.30(2H, m), 0.75-0.80(1H, m), 2.45(2H, t, J=6.9Hz), 2.90(2H, t, J=6.9Hz), 3.85-3.90(5H, m), 7.17(1H, d, J=8.8Hz), 7.26(1H, d, J=8.8Hz), 7.86(1H, s), 12.59(1H, br s)
71	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-CH ₃	2.47(2H, t, J=6.9Hz), 2.84(2H, t, J=6.9Hz), 3.86(3H, s), 4.04(2H, t, J=5.9Hz), 4.29(2H, t, J=5.9Hz), 6.77(2H, d, J=8.6Hz), 6.89(1H, t, J=8.6Hz), 7.1-7.3(4H, m), 7.82(1H, s), 13.2(1H, br s)

【0612】

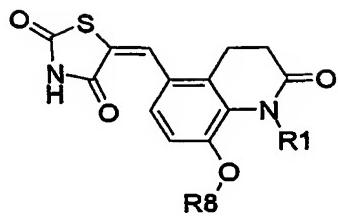
【表27】



実施例 R1	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
72 -CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₃	0.75-1.57(11H, m), 2.45(2H, t, J=6.9Hz), 2.88(2H, t, J=6.9Hz), 3.89(3H, s), 3.90-3.95(2H, m), 7.17(1H, d, J=8.8Hz), 7.25(1H, d, J=8.8Hz), 7.88(1H, s), 12.59(1H, br s)
73 -CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₃	2.46(2H, t, J=6.9Hz), 2.86(2H, t, J=6.9Hz), 3.10(3H, s), 3.35(2H, t, J=6.0Hz), 3.90(3H, s), 4.10(2H, t, J=6.0Hz), 7.17(1H, d, J=8.6Hz), 7.24(1H, t, J=8.6Hz), 7.86(1H, s), 12.6(1H, br s)
74 -CH(C ₆ H ₅) ₂	-CH ₃	2.47(2H, t, J=6.9Hz), 2.85(2H, t, J=6.9Hz), 3.40(3H, s), 6.29(1H, s), 7.00(1H, d, J=8.8Hz), 7.15-7.3(11H, m), 7.87(1H, s), 12.55(1H, br s)
75 -CH ₂ C ₆ H ₅	-H	2.41-2.60 (2H, m), 2.75-2.98 (2H, m), 5.31 (2H, s), 6.84 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.00-7.30 (6H, m), 7.81 (1H, s), 10.72 (1H, s), 12.48 (1H, brs).
76 -CH ₂ CH ₂ CN	-CH ₃	2.37-2.55 (2H, m), 2.78 (2H, t, J = 6.8 Hz), 2.83-2.98 (2H, m), 3.92 (3H, s), 4.06 (2H, t, J = 6.8 Hz), 7.19 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.27 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.85 (1H, s), 12.57 (1H, s).
77 -(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	-CH ₃	1.35-1.55(4H, m), 2.40-2.70(4H, m), 2.80(2H, t, J=6.9Hz), 3.83(3H, s), 3.85-3.95(2H, m), 7.05-7.3(7H, m), 7.85(1H, s), 12.7(1H, br s)
78 -(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	-CH ₃	1.05-1.15(2H, m), 1.35-1.5(4H, m), 2.35-2.70(4H, m), 2.77(2H, t, J=6.9Hz), 3.87(3H, s), 3.91(2H, t, J=7.0Hz), 7.05-7.3(7H, m), 7.83(1H, s), 12.6(1H, br s)
79 -(CH ₂) ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-CH ₃	1.13 (3H, t, J = 7.1 Hz), 2.17 (2H, t, J = 7.3 Hz), 2.35-2.47 (2H, m), 2.80-2.92 (2H, m), 3.79-3.84 (5H, m), 3.98 (2H, q, J = 7.1 Hz), 7.16 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.24 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.85 (1H, s), 12.54 (1H, s).

【0613】

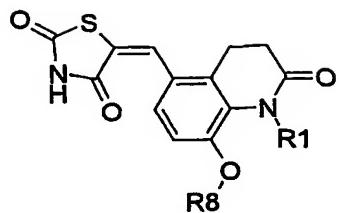
【表28】



実施例 R1	R8	*1H NMR δ ppm
80		-CH ₃ 2.60(2H, t, J=6.9Hz), 2.84(2H, t, J=6.9Hz), 3.70(3H, s), 5.64(2H, s), 6.95-8.05(10H, m), 12.5(1H, br s)
81		-CH ₃ 2.60(2H, t, J=6.9Hz), 2.99(2H, t, J=6.9Hz), 3.78(3H, s), 5.37(2H, s), 6.95-7.85(10H, m), 12.6(1H, br s)
82		-C ₂ H ₅ 0.82(3H, t, J=7.4Hz), 1.2-1.35(2H, m), 1.45-1.6(2H, m), 2.59(2H, t, J=6.9Hz), 2.97(2H, t, J=6.9Hz), 3.99(2H, t, J=6.4Hz), 5.21(2H, s), 7.0-7.65(11H, m), 7.85(1H, s), 12.6(1H, br s)
83		-CH ₂ CO ₂ C(CH ₃) ₃ CDCl ₃ : 1.53(9H, s), 2.70(2H, t, J=6.8Hz), 2.98(2H, t, J=6.8Hz), 4.46(2H, s), 5.47(2H, s), 6.69(1H, d, J=8.5Hz), 7.1-7.6(10H, m), 7.96(1H, s), 8.48(1H, br s)
84		-H 2.56(2H, t, J=6.9Hz), 2.93(2H, t, J=6.9Hz), 5.36(2H, s), 6.8-7.65(11H, m), 7.83(1H, s), 10.79(1H, s), 12.6(1H, br s)
85		-CH ₂ OCH ₃ CDCl ₃ : 2.6-2.8(m, 2H), 2.9-3.1(m, 2H), 3.44(s, 3H), 5.13(s, 2H), 5.32(s, 2H), 7.05-7.6(11H, m), 8.06(s, 1H)
86		-CH ₃ 7.45-7.65 (2H, m), 2.85-3.04 (2H, m), 3.72 (3H, s), 5.12 (2H, s), 7.03 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.06-7.31 (5H, m), 7.82 (1H, s), 12.53 (1H, brs).

*記載の無い場合測定溶媒 DMSO-d6

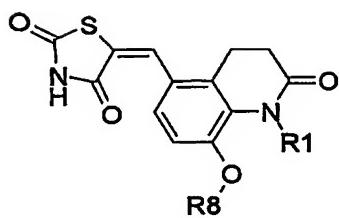
【表29】



実施例 R1	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
87		-CH3 2.48-2.51 (2H, m), 2.96-2.99 (2H, m), 3.75 (3H, s), 5.18 (2H, s), 6.88 (1H, d, J=10.3Hz), 7.06 (1H, d, J=10.3Hz), 7.53-7.74 (4H, m), 7.84 (1H, s), 8.09-8.10 (1H, m), 8.35 (1H, d, J=2.0Hz), 12.57 (1H, brs)
88		-CH3 2.48-2.51 (2H, m), 2.98-3.01 (2H, m), 3.75 (3H, s), 5.19 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=10.5Hz), 7.20 (1H, d, J=10.5Hz), 7.43-7.66 (4H, m), 7.82-7.84 (2H, m), 8.01-8.04 (2H, m), 8.43-8.45 (1H, m), 12.56 (1H, brs)
89		-CH3 DMSO overlap (2H), 2.80-2.85 (2H, m), 3.40-3.47 (4H, m), 3.61-3.68 (4H, m), 3.84 (3H, s), 5.11 (2H, s), 6.65 (1H, d, J=9.0Hz), 6.98-7.24 (3H, m), 7.77 (1H, s), 7.87 (1H, d, J=2.1Hz), 12.18 (1H, brs)
90		-CH3 2.84-2.89 (2H, m), 3.15-3.19 (4H, m), 3.25-3.30 (2H, m), 3.50-3.54 (4H, m), 3.86 (3H, s), 5.12 (2H, s), 6.69-6.90 (2H, m), 6.96 (2H, d, J=8.0Hz), 7.07 (1H, d, J=8.9Hz), 7.16-7.30 (4H, m), 7.81 (1H, s), 7.88 (1H, d, J=2.2Hz), 12.53 (1H, brs)
91		-CH3 2.35 (3H, s), 2.55-2.59 (4H, m), 2.83-2.89 (2H, m), 3.34-3.44 (6H, m), 3.84 (3H, s), 5.11 (2H, s), 6.68 (1H, d, J=8.6Hz), 7.04 (1H, d, J=8.8Hz), 7.20 (1H, d, J=8.8Hz), 7.26 (1H, dd, J1=2.2Hz, J2=8.8Hz), 7.68 (1H, s), 7.86 (1H, d, J=2.2Hz)

【0615】

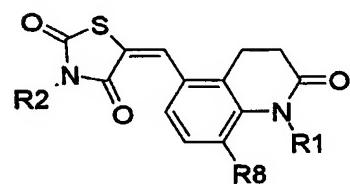
【表30】



実施例 R1	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
92		-CH3 2.50-2.58 (2H, m), 2.95-3.03 (2H, m), 3.71 (3H, s), 5.20 (2H, s), 7.04 (1H, d, J=8.7Hz), 7.21 (1H, d, 8.7Hz), 7.39-7.44 (1H, m), 7.61-7.70 (2H, m), 7.87-7.94 (1H, m), 8.25 (1H, d, J=8.2Hz), 8.32 (1H, d, J=8.0Hz), 8.45-8.46 (1H, m), 8.64 (1H, d, J=4.1Hz), NH n.d. (1H, brs)
93		-CH3 2.82-2.87 (2H, m), 3.05-3.10 (2H, m), 3.62 (3H, s), 5.32 (2H, s), 7.06 (1H, d, J=8.8Hz), 7.20 (1H, d, J=8.8Hz), 7.38 (1H, d, J=8.6Hz), 7.50-7.56 (1H, m), 7.67-7.73 (1H, m), 7.87-7.93 (1H, m), 8.24 (1H, d, J=8.5Hz), 12.56 (1H, brs)

【0616】

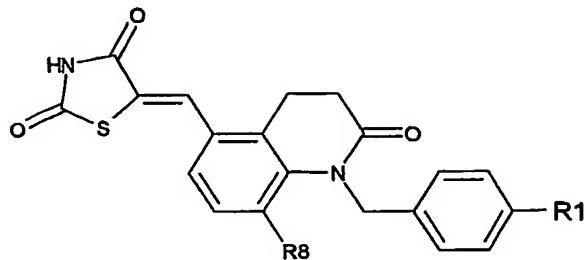
【表31】



実施例 R1	R2	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm	
94		-H -H	2.70-2.83 (2H, m), 2.98-3.15 (2H, m), 5.32 (2H, s), 6.99-7.10 (2H, m), 7.18-7.30 (1H, m), 7.35-7.54 (3H, m), 7.70 (1H, s), 7.75-7.90 (3H, m), 7.94 (1H, s), 12.63 (1H, s).	
95	-C6H5		-H -H	2.71-2.76 (2H, m), 3.10-3.33 (2H, m), 6.30 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.10-7.28 (4H, m), 7.40-7.57 (3H, m), 7.98 (1H, s), 12.66 (1H, s).
96		-H -H	2.69-2.75 (2H, m), 3.01-3.06 (2H, m), 5.21 (2H, s), 7.05-7.14 (2H, m), 7.31 (1H, t, J=8.0Hz), 7.45 (1H, d, J=8.3Hz), 7.69 (1H, dd, J1=2.4Hz, J2=8.3Hz), 7.92 (1H, s), 8.36 (1H, d, J=2.4Hz), 12.60 (1H, brs)	

【0617】

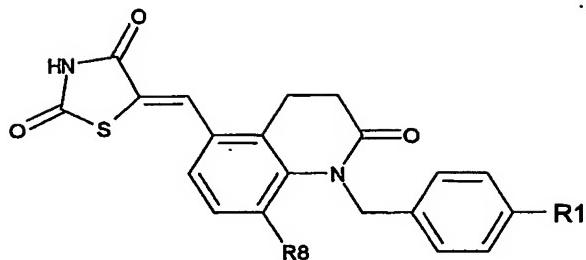
【表 3 2】



実施例	R1	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
97	-C ₆ H ₅	-H	2.68-2.81 (2H, m), 3.04 (2H, t, J = 6.6 Hz), 5.21 (2H, s), 7.01-7.15 (2H, m), 7.21-7.39 (4H, m), 7.39-7.50 (2H, m), 7.5-7.65 (4H, m), 7.93 (1H, s), 12.62 (1H, s).
98	-Br	-H	2.60-2.80 (2H, m), 2.95-3.10 (2H, m), 5.13 (2H, s), 6.99 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.09 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.11-7.32 (3H, m), 7.49 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.92 (1H, s), 12.64 (1H, s).
99	-Cl	-H	7.63-7.80 (2H, m), 2.92-3.10 (2H, m), 5.16 (2H, s), 7.01 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.10 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.20-7.31 (3H, m), 7.31-7.45 (2H, m), 7.93 (1H, s), 12.65 (1H, brs).
100	-CH ₃	-H	2.25 (3H, s), 2.49-2.51 (2H, m), 2.68-2.73 (2H, m), 5.12 (2H, s), 7.02 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.07-7.29 (6H, m), 7.93 (1H, s), 12.64 (1H, brs).
101	-C ₆ H ₅	-C ₆ H ₅	2.62-2.77 (2H, m), 2.89-3.07 (2H, m), 4.36 (2H, brs), 6.85 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.20-7.61 (14H, m), 7.93 (1H, s), 12.66 (1H, brs).
102	-CO ₂ CH ₃	-H	2.71-2.77 (2H, m), 3.02-3.08 (2H, m), 3.83 (3H, s), 5.24 (2H, s), 6.96 (1H, d, J=7.9Hz), 7.11 (1H, d, J=7.9Hz), 7.27 (1H, t, J=7.9Hz), 7.38 (2H, d, J=8.3Hz), 7.90 (2H, d, J=8.3Hz), 7.94 (1H, s), 12.64 (1H, brs)
103	-NO ₂	-H	2.72-2.78 (2H, m), 3.04-3.10 (2H, m), 5.31 (2H, s), 6.98 (1H, d, J=8.0Hz), 7.12 (1H, d, J=8.0Hz), 7.28 (1H, t, J=8.0Hz), 7.51 (2H, d, J=8.7Hz), 7.94 (1H, s), 8.18 (2H, d, J=8.7Hz), 12.66 (1H, brs)

【0618】

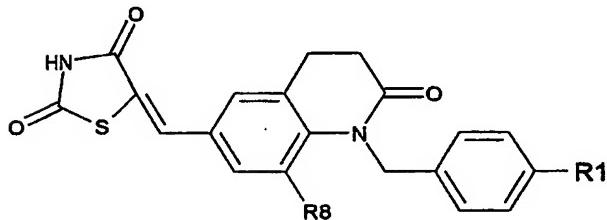
【表33】



実施例	R1	R8	1H NMR (CDCl3) δ ppm
104	-C6H5	-CH3	2.43 (3H, s), 2.57-2.63 (2H, m), 2.84-2.91 (2H, m), 5.12 (2H, s), 7.06-7.22 (4H, m), 7.22-7.60 (7H, m), 7.98 (1H, s), 8.42 (1H, brs).
105	-C6H5	-Cl	2.60-2.66 (2H, m), 2.85-2.92 (2H, m), 5.44 (2H, s), 7.11 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.18 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.23-7.48 (6H, m), 7.48-7.59 (2H, m), 7.91 (1H, s), 7.23 (1H, brs).

【0619】

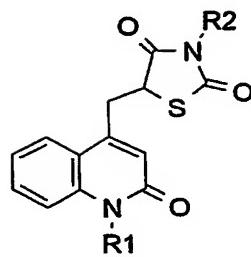
【表34】



実施例	R1	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
106	-C6H5	-H	2.70-2.84 (2H, m), 2.97-3.10 (2H, m), 5.22 (2H, s), 7.04-7.20 (2H, m), 7.20-7.49 (6H, m), 7.49-7.65 (4H, m), 7.68 (1H, s), 12.53 (1H, s).
107	-Br	-H	2.66-2.81 (2H, m), 2.91-3.09 (2H, m), 5.13 (2H, s), 7.03 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.36 (1H, dd, J = 2.0, 8.6 Hz), 7.40-7.55 (3H, m), 7.67 (1H, s), 12.54 (1H, brs).
108	-NO2	-H	2.71-2.87 (2H, m), 2.97-3.15 (2H, m), 5.31 (2H, s), 7.02 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.38 (1H, dd, J = 1.9, 8.6 Hz), 7.45-7.60 (3H, m), 7.69 (1H, s), 8.18 (2H, m), 12.55 (1H, brs).
109	-C6H5	-OCH3	2.55-2.70 (2H, m), 2.85-3.01 (2H, m), 3.78 (3H, s), 5.31 (2H, s), 7.07 (1H, s), 7.12 (1H, s), 7.21 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.25-7.35 (1H, m), 7.35-7.47 (2H, m), 7.54 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.60 (2H, d, J = 7.3 Hz), 7.68 (1H, s), 12.57 (1H, brs).
110	-C6H5	-CH3	2.36 (3H, s), 2.53-2.68 (2H, m), 2.79-3.04 (2H, m), 5.15 (2H, s), 7.22 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.25-7.36 (3H, m), 7.36-7.49 (2H, m), 7.50-7.70 (5H, m), 12.57 (1H, brs).

【0620】

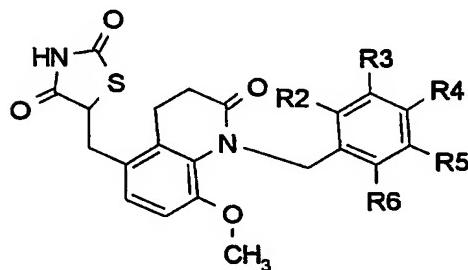
【表35】



実施例	R1	R2	融点(°C)
111	-H	-H	290-291
112	-CH ₃	-H	246-248
113	-CH ₃	-CH ₃	143-145
114		-H 	244.7-246.7

【0621】

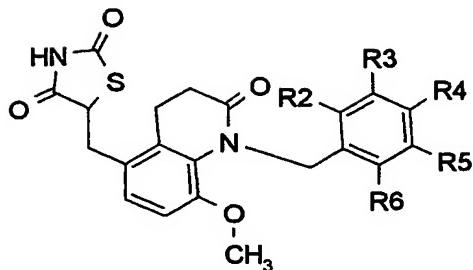
【表36】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	融点(°C)
115	-H	-H	-H	-H	-H	178-180
116	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	211-213
117	-H	-H	-H	-H	-H	210-215
118	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	215-217
119	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	246.5-246.6
120	-H	-H	-NH ₂	-H	-H	174.1-174.8
121	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	177.5-179.0
122	-H	-H	-Cl	-H	-H	190.5-191.8
123	-H	-H	-Br	-H	-H	178.1-179.0
124	-H	-H	-F	-H	-H	177.7-179.2
125	-H	-H	-CN	-H	-H	206.4-208.0
126	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	165.2-167.0
127	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	106.4-109.1
128	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	213.9-214.7

【0622】

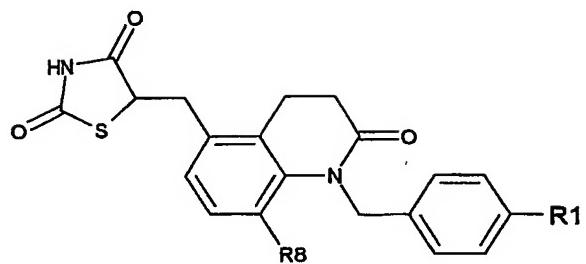
【表 37】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	¹ H NMR (DMSO-d6) δ ppm
129	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	2.39-2.52(m, 2H), 2.63-2.80(m, 2H), 3.06(dd; J=9.9, 14.4Hz, 1H), 3.33(S, 3H), 3.39(dd; J=4.2, 14.4Hz, 1H), 4.76(dd; J=4.2, 9.9Hz, 1H), 5.18(s, 2H), 6.69(d, J=8.6Hz, 1H), 6.86(d, J=8.6Hz, 1H), 7.04-7.47(m, 9H), 12.08(brs, 1H)
130	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	2.45-2.57(m, 2H), 2.79-2.90(m, 2H), 3.09(dd; J=10.1, 14.4Hz, 1H), 3.41(dd; J=4.3, 14.4Hz, 1H), 3.68(S, 3H), 4.77(dd; J=4.3, 10.1Hz, 1H), 5.26(s, 2H), 6.84(d, J=8.6Hz, 1H), 6.92(d, J=8.6Hz, 1H), 7.03(d, J=7.6Hz, 1H), 7.25-7.55(m, 8H), 12.09(brs, 1H)
131	-H	-H	-NHSO ₂ CH ₃	-H	-H	2.39-2.54 (2H, m), 2.72-2.87 (2H, m), 2.88 (3H, s), 3.05 (1H, dd, J = 10.0, 14.4 Hz), 3.39 (1H, dd, J = 4.0, 14.4 Hz), 3.67 (3H, s), 4.76 (1H, dd, J = 4.0, 10.0 Hz), 5.13 (2H, s), 6.80 (1H, d, J = 8.6 Hz), 6.89 (1H, d, J = 8.6 Hz), 6.93-7.06 (4H, m), 9.57 (1H, s), 12.05 (1H, s).

【0623】

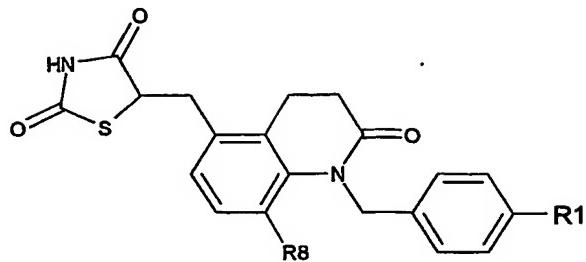
【表38】



実施例	R1	R8	融点(°C)
132	-C ₆ H ₅	-OCH ₂ CO ₂ H	128-133
133	-C ₆ H ₅	-H	198.1-199.2
134	-Br	-H	224.3-225.8
135	-Cl	-H	212.1-212.9
136	-CH ₃	-H	209.3-210.3
137	-CO ₂ CH ₃	-H	247-249
138	-NO ₂	-H	243-250

【0624】

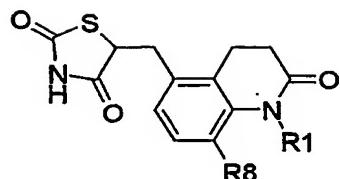
【表39】



実施例	R1	R8	1H NMR δ ppm
139	-C ₆ H ₅	-OC ₄ H ₉	0.82(t, J=7.4Hz, 3H), 1.25-1.33(m, 2H), 1.46-1.55(m, 2H), 2.45-2.56(m, 2H), 2.80-2.91(m, 2H), 3.11(dd; J=9.6, 14.4Hz, 1H), 3.41(dd; J=4.4, 14.4Hz, 1H), 3.84-3.92(m, 2H), 4.80(dd; J=4.4, 9.6Hz, 1H), 5.21(s, 2H), 6.87d, J=8.6Hz, 1H), 6.90(d, J=8.6Hz, 1H), 7.14(d, J=8.1Hz, 2H), 7.27-7.62(m, 7H), 12.08(brs, 1H)
140	-C ₆ H ₅	-CH ₃	2.28 (3H, s), 2.37-2.57 (2H, m), 2.67-2.94 (2H, m), 3.16 (1H, dd, J = 9.3, 14.3 Hz), 3.44 (1H, d, J = 4.4, 14.3 Hz), 4.83 (1H, dd, J = 4.4, 9.3 Hz), 4.95-5.20 (2H, m), 6.87 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.00 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.25-7.48 (3H, m), 7.51 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.60 (2H, d, J = 7.4 Hz), 12.07 (1H, brs).
141	-C ₆ H ₅	-Cl	2.43-2.62 (2H, m), 2.80-2.98 (2H, m), 3.21 (1H, dd, J = 9.3, 14.3 Hz), 3.45 (1H, dd, J = 4.7, 14.3 Hz), 4.84 (1H, dd, J = 4.7, 9.3 Hz), 5.31 (2H, s), 6.97 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.25 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.27-7.45 (3H, m), 7.50 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.59 (2H, d, J = 7.2. Hz), 12.10(1H, brs).
142	-C ₆ H ₅	-C ₆ H ₅	2.56-2.75 (2H, m), 2.80-3.00 (2H, m), 3.13-3.30 (1H, m), 3.45-3.60 (1H, m), 4.18-4.50 (2H, m), 4.90 (1H, dd, J = 4.5, 9.4 Hz), 6.80 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.04 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.12 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.21-7.64 (12H, m), 12.12 (1H, brs).
143	-CO ₂ H	-H	2.67-2.72 (2H, m), 2.97-3.02 (2H, m), 3.11-3.60 (2H, m), 4.85 (1H, dd, J1=4.6Hz, J2=10.7Hz), 5.21 (2H,s), 6.79 (1H, d, J=7.8Hz), 6.90 (1H, d, J=7.8Hz), 7.09 (1H, t, J=7.8Hz), 7.32 (2H, d, J=8.2Hz), 7.88 (2H, d, J=8.2Hz), 12.19 (1H, brs), 12.88 (1H, brs)
144	-C ₆ H ₅	-OCH ₂ CO ₂ C(CH ₃) ₃	CDCl ₃ :1.57(9H, s), 2.55-2.8(2H, m), 2.75-2.95(2H, m), 3.05-3.2(1H, m), 3.5-3.6(1H, m), 4.38(3H, s), 4.35-4.5(1H, m), 5.4-5.55(2H, m), 6.57(1H, d, J=8.6Hz), 6.87(1H, d, J=8.6Hz), 7.15-7.6(9H, m), 7.96(1H, br s)

*記載の無い場合測定溶媒 DMSO-d6

【表40】

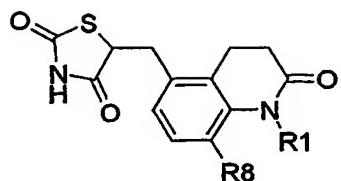


実施例 R1	R8	融点(°C)
145 -CH ₃	-OCH ₃	204-208
146 -H	-OCH ₃	253-256
147 -C ₂ H ₅	-OCH ₃	179-181
148 -CH ₂ CH ₂ CN	-OCH ₃	197.9-199.9
149 -(CH ₂) ₃ CO ₂ H	-OCH ₃	164.7-165.5
150 -C ₆ H ₅	-H	225.5-2272
151 -(CH ₂) ₃ CO ₂ C ₂ H ₅	-OCH ₃	154.7-156.0
152 -CH ₂ CH=CH ₂	-OCH ₃	160.0-161.5
153 -C ₈ H ₁₇	-OCH ₃	102.0-103.0
154	-OCH ₃	117-121
155	-OCH ₃	97-99
156	-OCH ₃	183-185
157	-OCH ₃	107-114
158	-H	228.1-230.0
159	-H	76-94
160	-H	261.5-263

【0626】

出証特2005-3094054

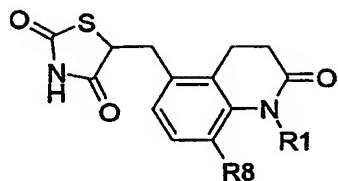
【表 4 1】



実施例 R1	R8	融点(°C)
161	-OCH ₃	121-126
162	-OCH ₃	135-137
163	-OCH ₃	215(分解)
164	-OCH ₃	104-109
165	-H	225-226

【0627】

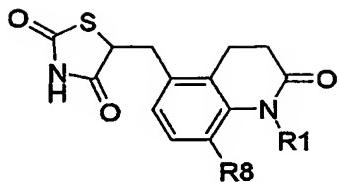
【表42】



実施例 R1	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
166 -(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	-OCH ₃	1.62-1.73(m, 2H), 2.32-2.45(m, 4H), 2.75-2.85(m, 2H), 3.10(dd; J=10.1, 14.4Hz, 1H), 3.44(dd; J=4.3, 14.4Hz, 1H), 3.70(S, 3H), 3.85-3.95(m, 2H), 4.81(dd; J=4.3, 10.1Hz, 1H), 6.93(d, J=8.6Hz, 1H), 6.98(d, J=8.6Hz, 1H), 7.04(d, J=7.5Hz, 2H), 7.14(t, J=7.5Hz, 1H), 7.22(t, J=7.5Hz, 2H), 12.10(brs, 1H)
167 -(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-OCH ₃	2.22-2.31(m, 2H), 2.32-2.55(m, 2H), 2.63-2.75(m, 2H), 3.05(dd; J=10.4, 14.5Hz, 1H), 3.41(dd; J=4.2, 14.5Hz, 1H), 3.87(S, 3H), 4.10-4.30(m, 2H), 4.69(dd; J=4.2, 10.4Hz, 1H), 6.90-7.05(m, 4H), 7.12-7.25(m, 3H), 12.12(brs, 1H)
168 -C ₄ H ₉	-OCH ₃	0.79(t; J=7.2Hz, 3H), 1.13(tt; J=7.2, 7.2Hz, 2H), 1.36(tt; J=7.2, 7.2Hz, 2H), 2.30-2.42(m, 2H), 2.70-2.80(m, 2H), 3.11(dd; J=9.8, 14.5Hz, 1H), 3.42(dd; J=4.4, 14.5Hz, 1H), 3.80(S, 3H), 3.92(t; J=7.2Hz, 2H), 4.80(dd; J=4.4, 9.8Hz, 1H), 6.80(d; J=8.6Hz, 1H), 6.97(d; J=8.6Hz, 1H), 12.09(brs, 1H)
169 -CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	-OCH ₃	0-0.05(m, 2H), 0.20-0.26(m, 2H), 0.73-0.84(m, 1H), 2.30-2.42(m, 2H), 2.70-2.85(m, 2H), 3.14(dd; J=9.6, 14.5Hz, 1H), 3.42(dd; J=4.4, 14.5Hz, 1H), 3.81(S, 3H), 3.84-3.90(m, 2H), 4.82(dd; J=4.4, 9.6Hz, 1H), 6.94(d; J=8.6Hz, 1H), 6.98(d; J=8.6Hz, 1H), 12.07(brs, 1H)
170 -(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-OCH ₃	2.35-2.47(m, 2H), 2.70-2.83(m, 2H), 3.07(dd; J=10.2, 14.5Hz, 1H), 3.42(dd; J=4.2, 14.5Hz, 1H), 3.79(S, 3H), 4.00-4.07(m, 2H), 4.21-4.30(m, 2H), 4.73(dd; J=4.2, 10.2Hz, 1H), 6.79(d, J=7.7Hz, 2H), 6.88(t, J=7.7Hz, 1H), 6.95(d, J=8.7Hz, 1H), 6.98(d, J=8.7Hz, 1H), 7.21(t, J=7.7Hz, 2H), 12.11(brs, 1H)

【0628】

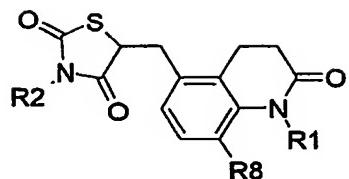
【表43】



実施例 R1	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
171 -CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	-OCH ₃	0.71-0.80(m, 2H), 0.94-1.07(m, 3H), 1.20-1.27(m, 1H), 1.37-1.45(m, 2H), 1.45-1.59(m, 3H), 2.34-2.44(m, 2H), 2.71-2.82(m, 2H), 3.13(dd; J=9.4, 14.4Hz, 1H), 3.42(dd; J=4.4, 14.4Hz, 1H), 3.80(S, 3H), 3.89-3.99(m, 2H), 4.82(dd; J=4.4, 9.4Hz, 1H), 6.94(d, J=8.6Hz, 1H), 6.97(d, J=8.6Hz, 1H), 12.06(brs, 1H)
172 -CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-OCH ₃	2.35-2.44(m, 2H), 2.71-2.80(m, 2H), 3.08(S, 3H), 3.11(dd; J=9.8, 14.5Hz, 1H), 3.25-3.36(m, 2H), 3.42(dd; J=4.3, 14.5Hz, 1H), 3.80(S, 3H), 4.03-4.12(m, 2H), 4.80(dd; J=4.3, 9.8Hz, 1H), 6.95(d, J=8.6Hz, 1H), 6.98(d, J=8.6Hz, 1H), 12.09(brs, 1H)
173 -(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	-OCH ₃	0.75-0.85(6H, m), 1.2-1.5(3H, m), 2.3-2.5(2H, m), 2.6-2.9(2H, m), 3.0-3.15(1H, m), 3.35-3.5(1H, m), 3.80(3H, s), 3.94(2H, t, J=7.1Hz), 4.75-4.85(1H, m), 6.9-7.1(2H, m), 12.05(1H, br s)
174 -(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	-OCH ₃	1.38-1.45(m, 4H), 2.33-2.42(m, 2H), 2.44-2.50(m, 2H), 2.70-2.81(m, 2H), 3.10(dd; J=10.0, 14.5Hz, 1H), 3.42(dd; J=4.3, 14.5Hz, 1H), 3.74(S, 3H), 3.88-3.96(m, 2H), 4.80(dd; J=4.3, 10.0Hz, 1H), 6.93(d, J=8.6Hz, 1H), 6.97(d, J=8.6Hz, 1H), 7.10(d, J=7.3Hz, 2H), 7.14(t, J=7.3Hz, 1H), 7.23(t, J=7.3Hz, 2H), 12.10(brs, 1H)
175 -(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	-OCH ₃	1.04-1.15(m, 2H), 1.35-1.50(m, 4H), 2.32-2.41(m, 2H), 2.42-2.53(m, 2H), 2.65-2.73(m, 2H), 3.09(dd; J=10.0, 14.5Hz, 1H), 3.42(dd; J=4.3, 14.5Hz, 1H), 3.78(S, 3H), 3.86-3.96(m, 2H), 4.78(dd; J=4.3, 10.0Hz, 1H), 6.94(d, J=8.6Hz, 1H), 6.97(d, J=8.6Hz, 1H), 7.11(d, J=7.5Hz, 2H), 7.15(t, J=7.5Hz, 1H), 7.24(t, J=7.5Hz, 2H), 12.10(brs, 1H)

【0629】

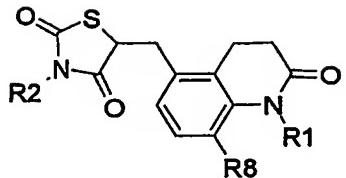
【表 4-4】



実施例 R1	R2	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
176	-H	-OCH ₃	1.25-1.45 (4H, m), 1.45-1.70 (4H, m), 2.09 (2H, t, J = 7.7 Hz), 2.31-2.48 (2H, m), 2.65-2.88 (2H, m), 3.00-3.21 (3H, m), 3.21-3.50 (3H, m), 3.79 (3H, s), 3.85-4.00 (2H, m), 4.78 (1H, dd, J = 4.2, 10.0 Hz), 6.86-8.09 (2H, m), 12.08 (1H, brs).
177	-H	-OCH ₃	2.45-2.51 (2H, m), 2.82-2.88 (2H, m), 3.06-3.14 (1H, m), 3.37-3.45 (1H, m), 3.66 (3H, s), 4.79 (1H, dd, J1=4.4Hz, J2=9.5Hz), 5.18 (2H, s), 6.85 (1H, d, J=8.6Hz), 6.91 (1H, d, J=8.6Hz), 7.39-7.66 (5H, m), 7.78-7.81 (2H, m), 8.43 (1H, d, J=2.0Hz), 12.06 (1H, brs)
178	-H	-OCH ₃	2.44-2.50 (2H, m), 2.67-2.73 (2H, m), 2.98-3.18 (2H, m), 2.98-3.25 (6H, m), 3.32-3.64 (4H, m), 3.75 (3H, s), 4.68-4.72 (1H, m), 5.09 (2H, s), 6.63 (1H, d, J=8.9Hz), 6.82-6.98 (2H, m), 7.18-7.22 (1H, m), 7.85 (1H, d, J=2.1Hz), 12.02 (1H, brs)

【0630】

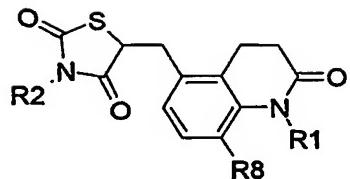
【表 4 5】



実施例	R1	R2	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
179		-H	-OCH ₃	2.20 (3H, s), 2.34-2.38 (4H, m), 2.51-2.56 (2H, m), 2.71-2.76 (2H, m), 2.97-3.05 (1H, m), 3.30-3.39 (5H, m), 3.75 (3H, s), 4.65-4.70 (1H, m), 5.08 (2H, s), 6.62 (1H, d, J=8.7Hz), 6.83 (1H, d, J=8.6Hz), 6.90 (1H, d, J=8.6Hz), 7.17 (1H, dd, J1=2.4Hz, J2=8.7Hz), 7.83 (1H, d, J=2.4Hz), NH n. d. (1H)
180		-H	-OCH ₃	2.55-2.57 (2H, m), 2.87-2.89 (2H, m), 3.07-3.14 (1H, m), 3.39-3.46 (1H, m), 3.64 (3H, s), 4.76-4.82 (1H, m), 5.19 (2H, s), 6.85 (1H, d, J=8.5Hz), 6.93 (1H, d, J=8.5Hz), 7.38-7.43 (1H, m), 7.61 (1H, dd, J1=2Hz, J2=8.2Hz), 7.90 (1H, ddd, J1=1.5Hz, J2=7.8Hz, J3=7.9Hz), 8.24 (1H, d, J=8.2Hz), 8.32 (1H, d, J=7.9Hz), 8.45 (1H, d, J=1.5Hz), 8.64 (1H, d, J=4.6Hz), 12.06 (1H, brs)
181		-H	-OCH ₃	2.55-2.60 (2H, m), 3.02-3.07 (2H, m), 3.11-3.16 (1H, m), 3.41-3.46 (1H, m), 3.52 (3H, s), 4.80-4.86 (1H, m), 5.30 (2H, s), 6.84 (1H, d, J=8.5Hz), 6.93 (1H, d, J=8.5Hz), 7.33 (1H, d, J=8.6Hz), 7.50-7.56 (1H, m), 7.66-7.72 (1H, m), 7.88-7.91 (1H, m), 8.21 (1H, d, J=8.6Hz), 12.12 (1H, brs)

【0631】

【表46】

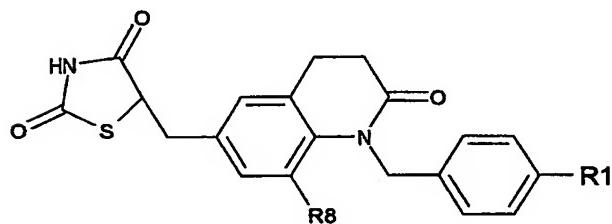


実施例	R1	R2	R8	* ¹ H NMR δ ppm
182		-CH ₂ OCH ₃	-OCH ₂ OCH ₃	CDCl ₃ : 2.55-2.75(2H, m), 2.75-3.0(2H, m), 3.05-3.15(1H, m), 3.28(3H, s), 3.38(3H, s), 3.55-3.65(1H, m), 4.35-4.45(1H, m), 4.9-5.1(4H, m), 5.25-5.4(2H, m), 6.88(1H, d, J=8.6Hz), 6.97(1H, d, J=8.6Hz), 7.1-7.6(9H, m)
183		-CH ₂ OCH ₃	-OH	2.45-2.55(2H, m), 2.75-2.9(2H, m), 3.05-3.2(4H, m), 3.35-3.45(1H, m), 4.7-5.0(3H, m), 5.34(2H, s), 6.65(1H, d, J=8.4Hz), 6.76(1H, d, J=8.4Hz), 7.1-7.7(9H, m), 9.94(1H, br s)

*記載の無い場合測定溶媒 DMSO-d6

【0632】

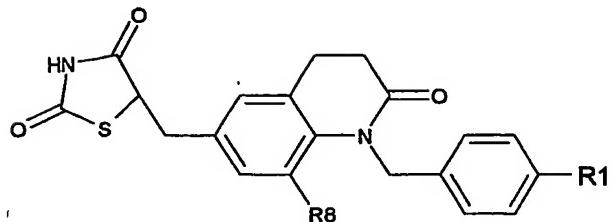
【表47】



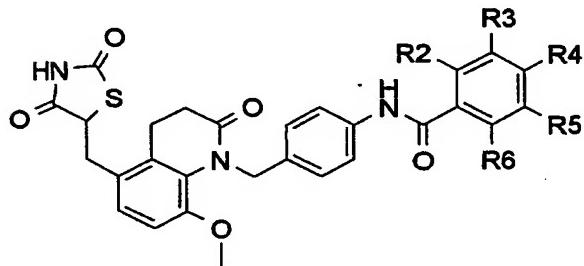
実施例	R1	R8	融点(°C)
184	-Br	-H	193.4-195.0
185	-NO ₂	-H	215.5-216.1

【0633】

【表 4 8】



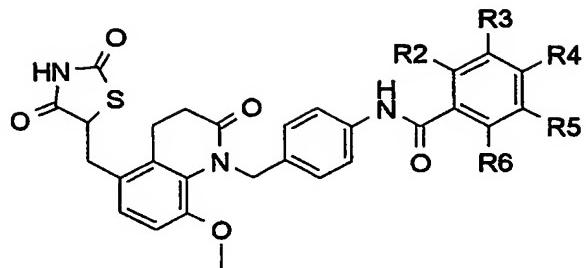
実施例	R1	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
186	-C ₆ H ₅	-H	2.62-2.76 (2H, m), 2.85-3.07 (3H, m), 3.20-3.40 (1H, m), 4.85 (1H, dd, J = 4.2, 9.7 Hz), 5.16 (2H, s), 6.89 (1H, d, J = 8.3 Hz), 6.96-7.06 (1H, m), 7.11 (1H, s), 7.24-7.38 (3H, m), 7.38-7.50 (2H, m), 7.50-7.68 (4H, m), 12.02 (1H, s).
187	-C ₆ H ₅	-OCH ₃	2.48-2.60 (2H, m), 2.60-2.88 (2H, m), 2.90-3.06 (1H, m), 3.26-3.40 (1H, m), 3.70 (3H, s), 4.82-4.95 (1H, m), 5.24 (2H, s), 6.73 (1H, d, J = 1.5 Hz), 6.80 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.18 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.25-7.37 (1H, m), 7.37-7.46 (2H, m), 7.46-7.55 (2H, m), 7.55-7.68 (2H, m), 12.06 (1H, brs).
188	-C ₆ H ₅	-CH ₃	2.26 (3H, s), 2.45-2.60 (2H, m), 2.70-2.85 (2H, m), 2.87-3.05 (1H, m), 3.18-3.40 (1H, m), 4.87 (1H, dd, J = 4.3, 9.8 Hz), 5.07 (2H, s), 6.93 (1H, s), 6.98 (1H, s), 7.18 (2H, m), 7.27-7.38 (1H, m), 7.38-7.48 (2H, m), 7.48-7.56 (2H, m), 7.56-7.66 (2H, m), 12.06 (1H, s).

【0634】
【表 4 9】

実施例	R2	R3	R4	R5	R6	融点(°C)
189	-H	-H	-H	-H	-H	231.1-232.2
190	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	208-209
191	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	199-200
192	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	209
193	-H	-H	-Cl	-H	-H	223-225

【0635】

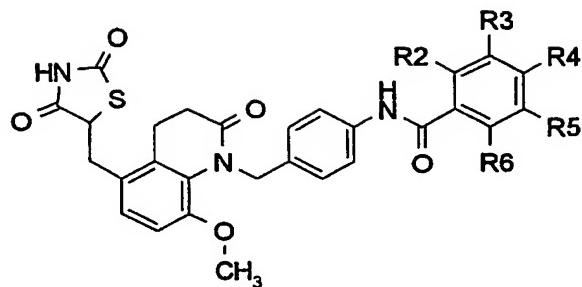
【表50】



実施例	R_2	R_3	R_4	R_5	R_6	$^1\text{H NMR} (\text{DMSO}-\text{d}_6)$	δ ppm
194	-H	-H	-H	- OCH_3	-H	2.46-2.52 (2H, m), 2.81-2.87 (2H, m), 3.01-3.11 (1H, m), 3.33-3.44 (1H, m), 3.71 (3H, s), 3.82 (3H, s), 4.58-4.61 (1H, m), 5.18 (2H, s), 6.82 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 6.90 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.03 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.11-7.15 (1H, m), 7.38-7.50 (3H, m), 7.57 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 10.10 (1H, s), 12.07 (1H, s)	
195	-H	-H	- OC_6H_5	-H	-H	2.44-2.52 (2H, m), 2.80-2.86 (2H, m), 3.01-3.11 (1H, m), 3.33-3.72 (1H, m), 3.72 (3H, s), 4.78 (1H, dd, $J_1=4.4\text{Hz}$, $J_2=9.9\text{Hz}$), 5.18 (2H, s), 6.82 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 6.90 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 7.00-7.12 (6H, m), 7.19-7.25 (1H, m), 7.42-7.48 (2H, m), 7.57 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.94 (2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 10.08 (1H, s), 12.07 (1H, s)	
196	-H	-H	-H	-H	-Cl	2.44-2.50 (2H, m), 2.80-2.86 (2H, m), 3.06 (1H, dd, $J_1=9.9\text{Hz}$, $J_2=14.5\text{Hz}$), 3.37-3.47 (1H, m), 3.73 (3H, s), 4.78 (1H, dd, $J_1=4.2\text{Hz}$, $J_2=9.9\text{Hz}$), 5.19 (2H, s), 6.82 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 6.90 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.02 (2H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 7.37-7.54 (6H, m), 10.37 (1H, s), 12.05 (1H, s)	
197	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	2.46-2.52 (2H, m), 2.82-2.88 (2H, m), 3.02-3.12 (1H, m), 3.32-3.42 (1H, m), 3.74 (3H, s), 4.76-4.79 (1H, m), 5.15 (2H, s), 6.78 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 6.91 (1H, d, $J=8.4\text{Hz}$), 7.04 (2H, d, $J=8.2\text{Hz}$), 7.48-7.56 (5H, m), 10.63 (1H, s), 12.07 (1H, s)	

【0636】

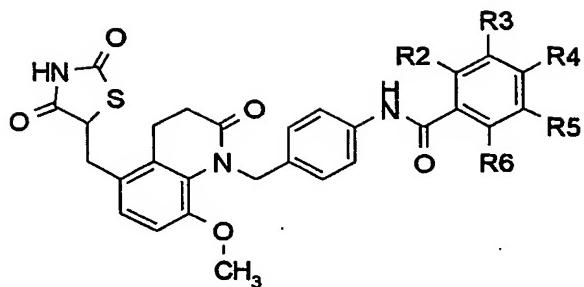
【表 5 1】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
198	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	573
199	-H	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	573
200	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	584
201	-H	-H	-H	-H	-NO ₂	561
202	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	592
203	-H	-H	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	559
204	-H	-H	-H	-H	-NHC ₆ H ₅	607
205	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	584
206	-H	-H	-H	-CN	-H	541
207	-H	-H	-H	-NO ₂	-H	561
208	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	608
209	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	548
210	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	558
211	-H	-H	-H	-H	-CF ₃	584
212	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	584
213	-H	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	608
214	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	608
215	-H	-H	-F	-H	-Cl	568
216	-H	-H		-H	-H	599
217	-H	-H	-1-PYRRYL	-H	-H	581
218	-H	-H		-H	-H	582
219	-H	-H		-H	-H	583

【0637】

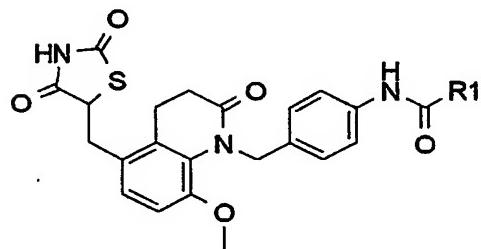
【表52】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
220	-H	-H		-H	-H	582
221	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	546
222	-H	-Cl	-H	-H	-OCH ₃	580
223	-H	-H	-Cl	-H	-H	550
224	-H	-H	-H	-H	-H	516

【0638】

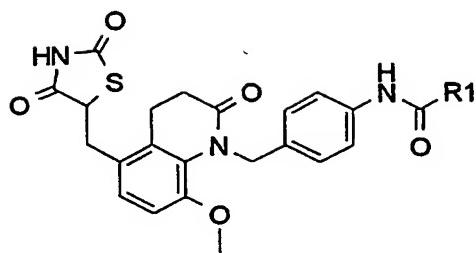
【表53】



実施例	R1	融点(°C)
225	-cyclo-C ₆ H ₁₁	124.7-126.4
226	-NHC ₆ H ₅	233.0-234.6
227	-NHC ₂ H ₅	195.7-196.9
228	-C ₂ H ₅	198.3-200.3
229	-CH ₃	215.2-217.8
230	-OCH ₃	136.3-138.6
231	-3-PYRIDYL	233.0-234.2
232	-OC ₅ H ₁₁	98-102
233		166-168
234	-OCH ₂ C ₆ H ₅	186-189

【0639】

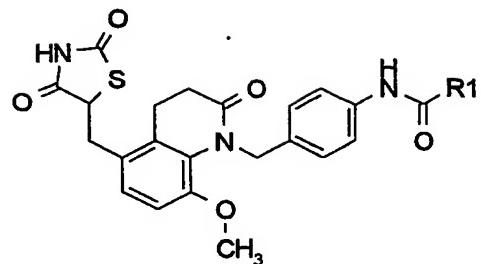
【表54】



実施例 R1	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
235 -2-FURYL	2.44-2.52 (2H, m), 2.76-2.81 (2H, m), 3.01-3.11 (1H, m), 3.32-3.42 (1H, m), 3.71 (3H, s), 4.76-4.79 (1H, m), 5.17 (2H, s), 6.67 (1H, dd, J1=1.7Hz, J2=3.5Hz), 6.82 (1H, d, J=8.6Hz), 6.90 (1H, d, J=8.5Hz), 7.01 (2H, d, J=8.5Hz), 7.28 (1H, dd, J1=0.7Hz, J2=3.5Hz), 7.55 (2H, d, J=8.6Hz), 7.90 (1H, dd, J1=0.7Hz, J2=1.7Hz), 10.06 (1H, s), 12.06 (1H, s)
236	 2.44-2.52 (2H, m), 2.82-2.88 (2H, m), 3.03-3.13 (1H, m), 3.35-3.45 (1H, m), 3.73 (3H, s), 4.79 (1H, dd, J1=4.1Hz, J2=9.9Hz), 5.20 (2H, s), 6.83 (1H, d, J=8.6Hz), 6.91 (1H, d, J=8.6Hz), 7.05 (2H, d, J=8.4Hz), 7.58-7.66 (4H, m), 7.95-8.08 (4H, m), 8.52 (1H, s), 10.33 (1H, s), 12.06 (1H, s)
237	 2.44-2.52 (2H, m), 2.79-2.85 (2H, m), 3.00-3.10 (1H, m), 3.36-3.46 (1H, m), 3.70 (3H, s), 3.74 (3H, s), 4.74-4.78 (1H, m), 5.15 (2H, s), 6.80 (1H, d, J=8.7Hz), 6.91-7.00 (5H, m), 7.06-7.11 (2H, m), 7.30 (2H, d, J=8.5Hz), 10.01 (1H, s), 12.05 (1H, s)

【0640】

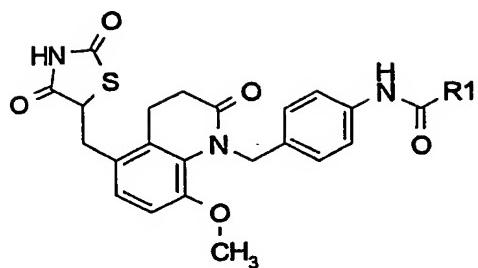
【表55】



実施例	R1	MS(M+1)
238	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	560
239	-3-PYRIDYL	517
240	-4-PYRIDYL	517
241	-2-FURYL	506
242	-2-THIENYL	522
243	-3-FURYL	506
244	-3-THIENYL	522
245	-cyclo-C ₅ H ₉	508
246	-cyclo-C ₆ H ₁₁	522
247	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	536
248	-CH ₂ OC ₆ H ₅	546
249	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	544
250	-2-PYRIDYL	517
251	-CH=CHC ₆ H ₅ (trans)	542
252	-OC ₆ H ₅	532
253	-OC ₃ H ₇	498
254	-OC ₅ H ₁₁	526
255	-OCH ₂ C ₆ H ₅	546
256	-OCH ₃	470
257	-OC ₄ H ₉	512

【0641】

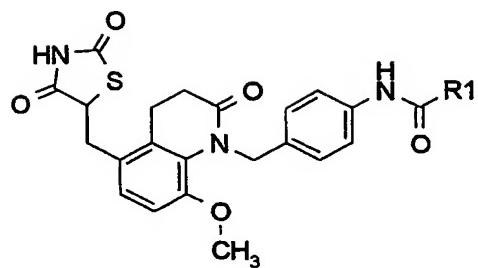
【表 56】



実施例 R1	MS(M+1)
258	545
259	531
260	531
261	536
262	582
263	536
264	522
265	627
266	565

【0642】

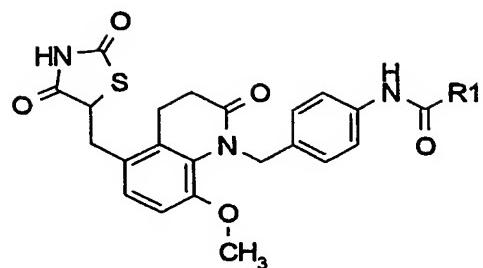
【表57】



実施例 R1	MS(M+1)
267	572
268	566
269	566
270	560
271	599
272	585
273	551
274	564
275	576

【0643】

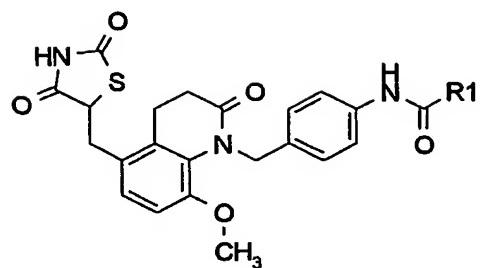
【表58】



実施例 R1	MS(M+1)
276	586
277	543
278	543
279	551
280	563
281	555
282	555
283	505
284	523

【0644】

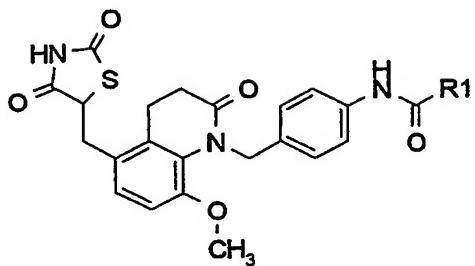
【表59】



実施例 R1	MS(M+1)
285	556
286	585
287	569
288	572
289	543
290	535
291	518
292	566
293	562

【0645】

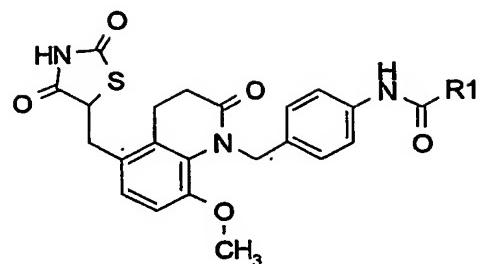
【表60】



実施例 R1	MS(M+1)
294	582
295	550
296	546
297	580
298	494
299	577
300	502
301	510
302	546
303	518

【0646】

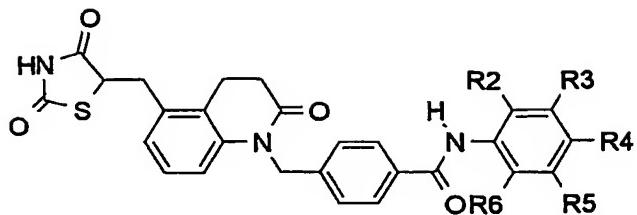
【表61】



実施例 R1		MS(M+1)
304		562
305		612
306		590
307		594
308		591
309		568

【0647】

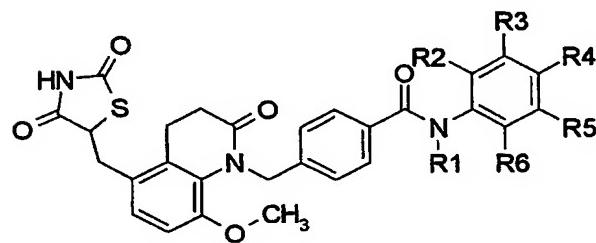
【表62】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	融点(°C)
310	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	226
311	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	139-142
312	-H	-H	-Cl	-H	-H	154-158
313	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	225-230

【0648】

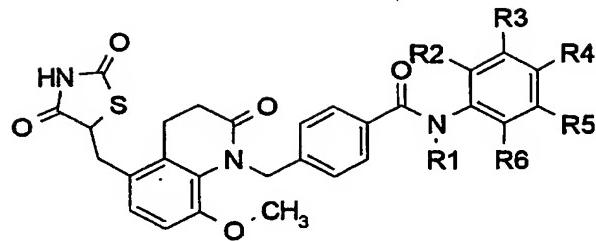
【表63】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	融点(°C)
314	-H	-H	-H	-H	-H	-H	242.7-243.5
315	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	240-241
316	-H	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	243-244
317	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	152-156
318	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	215-216
319	-H	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	203-204

【0649】

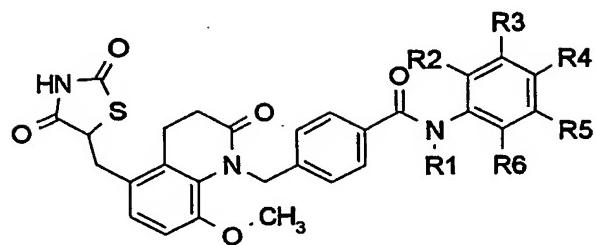
【表64】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
320	-H	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	546
321	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	560
322	-H	-H	-H	-H	-SCH ₃	-H	562
323	-H	-H	-H	-H	-H	-SCH ₃	562
324	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	584
325	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	600
326	-H	-H	-H	-H	-H	-H	516
327	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	550
328	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	546
329	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	546
330	-H	-H	-H	-H	-Cl	-H	550
331	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	530
332	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	576
333	-H	-OCH ₃	-H	-H	-Cl	-H	580
334	-H	-OCH ₃	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	603
335	-H	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	576
336	-H	-H	-H	-H	-H	-C(CH ₃)=CH ₂	556
337	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	600
338	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	530
339	-H	-H	-H	-H	-H	-F	534
340	-H	-H	-H	-H	-F	-H	534
341	-H	-H	-H	-F	-H	-H	534
342	-H	-H	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	559
343	-H	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	560
344	-H	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	584
345	-H	-H	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	573
346	-H	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	573
347	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	544
348	-H	-H	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	608
349	-H	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	608
350	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	608

【0650】

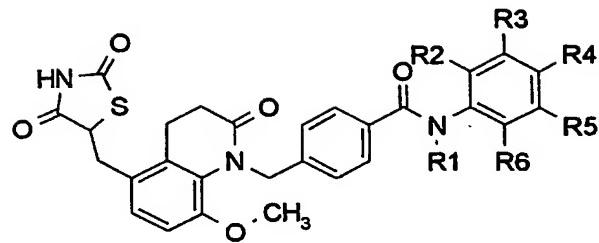
【表65】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
351	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	584
352	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	584
353	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	544
354	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	544
355	-H	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	544
356	-H	-H	-F	-H	-F	-H	552
357	-H	-H	-H	-OCH ₃	-F	-H	564
358	-H	-H	-H	-SO ₂ NH ₂	-H	-H	595
359	-H	-H	-H	-CH ₃	-OCH ₃	-H	560
360	-H	-H	-H	-OCH ₃	-Cl	-H	580
361	-H	-H	-H	-CH ₃	-Cl	-H	564
362	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CF ₃	-H	614
363	-H	-H	-H	-F	-Cl	-H	568
364	-H	-H	-H	-OH	-Cl	-H	566
365	-H	-Cl	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	607
366	-H	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	562
367	-H	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	558
368	-H	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	572
369	-H	-H	-H	-NHSO ₂ CH ₃	-H	-H	609
370	-H	-H	-H	-CONHCH ₃	-H	-H	573
371	-H	-H	-H	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	622
372	-H	-H	-H	-CH=CH ₂	-H	-H	544
373	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	564
374	-H	-H	-H	-H	-H	-Cl	550
375	-H	-H	-CN	-H	-H	-H	541
376	-H	-H	-H	-F	-H	-Cl	568
377	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	541

【0651】

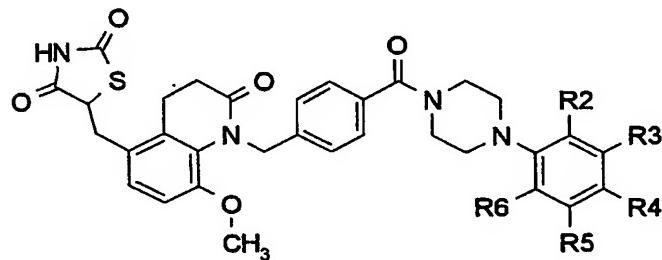
【表66】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
378	-H	-H	-H			-H	599
379	-H	-H	-H			-H	614

【0652】

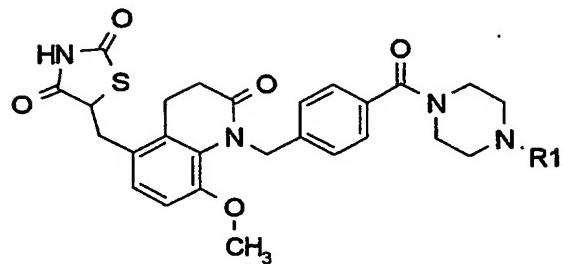
【表67】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
380	-H	-H	-H	-Cl	-H	619
381	-H	-H	-H	-H	-F	603
382	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	615
383	-H	-H	-F	-H	-H	603
384	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	653
385	-H	-H	-CN	-H	-H	610
386	-H	-H	-H	-H	-H	585

【0653】

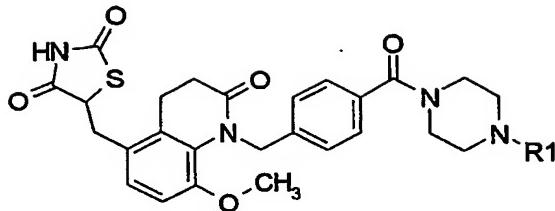
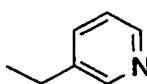
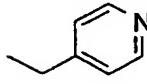
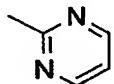
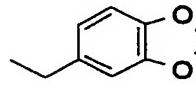
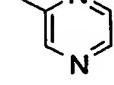
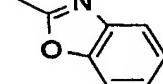
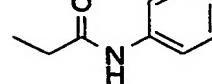
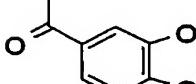
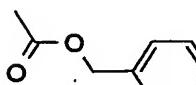
【表68】



実施例	R1	MS(M+1)
387	-2-PYRIDYL	586
388	-cyclo-C ₅ H ₉	577
389	-4-PYRIDYL	586
390	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	613
391	-CH ₃	613
392	-C(CH ₃) ₃	579
393	-3-PYRIDYL	586
394	-H	508

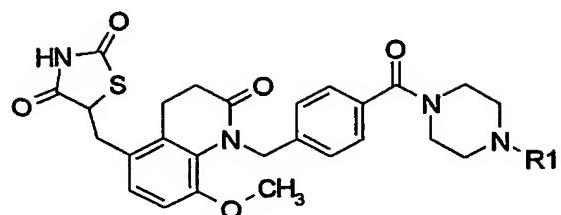
【0654】

【表69】

		
実施例 R1	MS(M+1)	
395	600	
396	600	
397	587	
398	643	
399	587	
400	626	
401	642	
402	657	
403	643	

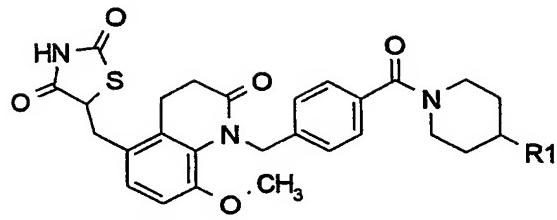
【0655】

【表70】



実施例 R1		MS(M+1)
404		611
405		589
406		593
407		609
408		603
409		600
410		600
411		614
412		635
413		668

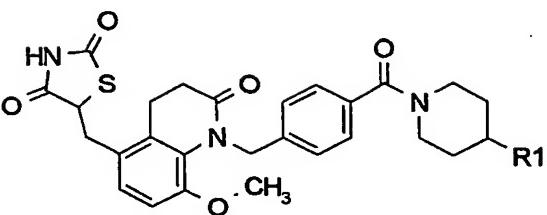
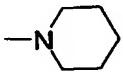
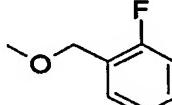
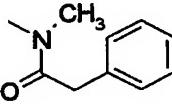
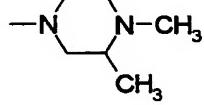
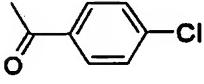
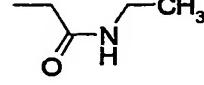
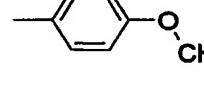
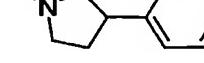
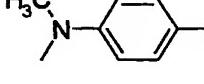
【0656】
【表71】



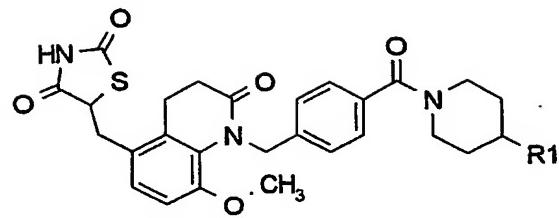
実施例 R1	MS(M+1)
414 -OCH ₃	538
415 -cyclo-C ₆ H ₁₁	590
416 -CH ₂ C ₆ H ₅	598
417 -C ₆ H ₅	584

【0657】

【表72】

		
実施例 R1	MS(M+1)	
418	591	
419	632	
420	655	
421	620	
422	646	
423	632	
424	593	
425	614	
426	653	
427	647	

【0658】
【表73】



実施例 R1	MS(M+1)
428 	632
429 	632
430 	630
431 	616
432 	593
433 	600
434 	624

【0659】

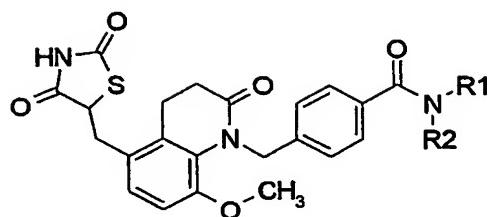
【表74】



実施例	R1	R2	融点(°C)
435	-C ₂ H ₅	-H	277.7-279.1
436	-CH(CH ₃) ₂	-H	256.5-257.4
437	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	248.1-249.9
438	-3-PYRIDYL	-H	251.9-254.1

【0660】

【表 75】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
439	-3-PYRIDYL	-H	517
440	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₃	536
441	-C ₄ H ₉	-C ₄ H ₉	552
442	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	552
443	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	-C ₃ H ₇	536
444	-cyclo-C ₅ H ₉	-CH ₂ CH=CH ₂	548
445	-C ₄ H ₉	-H	496
446	-cyclo-C ₃ H ₅	-H	480
447	-CH ₂ C ₆ H ₅	-H	530
448	-CH ₂ C ₆ H ₅	-cyclo-C ₆ H ₁₁	612
449	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	572
450	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-C ₂ H ₅	550
451	-C ₃ H ₇	-H	482
452	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	-C ₂ H ₅	564
453	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	-H	512
454	-1-CH ₃ -CYCLOHEXYL	-H	536
455	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	536
456	-CH(CH ₃)C ₆ H ₅	-H	544
457	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	-H	558
458	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-H	544
459	-CH ₂ CONH ₂	-H	497
460	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-CH ₃	526
461	-C ₅ H ₁₁	-CH ₃	524
462	-2-PYRIDYL	-H	517

【0661】

【表76】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
463		-CH ₃	559
464		-CH ₃	551
465		-C ₂ H ₅	566
466		-H	558
467		-H	564
468		-H	564
469		-H	564
470		-H	531
471		-H	531
472		-H	531

【0662】

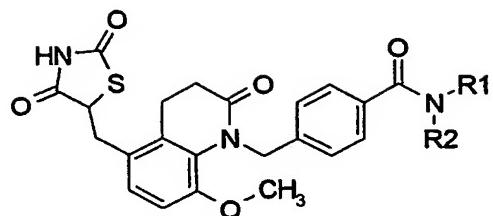
【表77】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
473		-H	520
474		-CH ₃	641
475		-CH ₃	579
476		-CH ₂ C ₆ H ₅	601
477		-CH ₃	615
478		-CH ₃	558
479		-CH ₃	588
480		-CH ₃	574
481		-C ₂ H ₅	559

【0663】

【表78】



実施例 R1	R2	MS(M+1)
482	-C ₂ H ₅	602
483	-H	572
484	-CH ₃	647
485	-H	494
486	-H	522
487	-H	574
488	-H	614
489	-H	578
490	-H	574
491	-H	548

【0664】

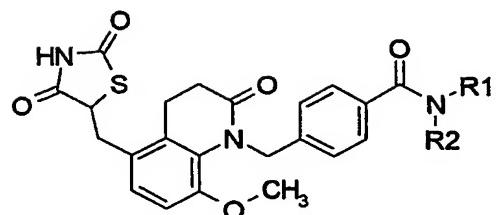
【表79】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
492		-H	548
493		-H	567
494		-H	618
495		-H	577
496		-H	592
497		-H	524
498		-C ₂ H ₅	626
499		-CH ₃	601

【0665】

【表80】



実施例 R1	R2	MS(M+1)
500		-C ₂ H ₅ 592
501		-C ₂ H ₅ 626
502		-C ₂ H ₅ 638
503		-H 560
504		-H 562
505		-H 562
506		-H 551
507		-H 537
508		-H 553
509		-H 567

【0666】

【表81】



実施例 R1	R2	MS(M+1)
510	-H	536
511	-CH ₃	659
512	-H	531
513	-H	547
514	-H	555
515	-H	531
516	-H	523
517	-H	507
518	-H	508
519	-H	521

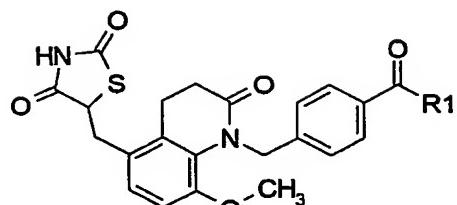
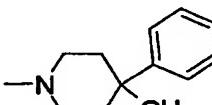
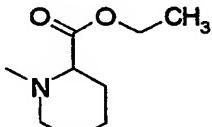
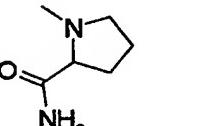
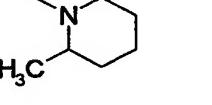
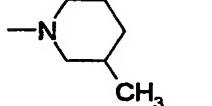
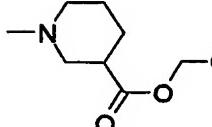
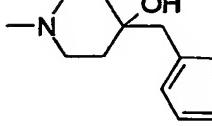
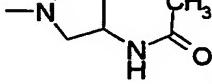
【0667】

【表82】

実施例 R1	MS(M+1)
520	522
521	539
522	526
523	520
524	512
525	548
526	536
527	599
528	556

【0668】

【表83】

		
実施例 R1	MS(M+1)	
529	600	
		
530	580	
		
531	537	
		
532	522	
		
533	522	
		
534	580	
		
535	614	
		
536	551	
		

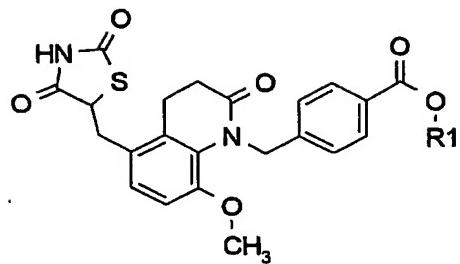
【0669】

【表84】

実施例 R1	MS(M+1)
537 	538
538 	607
539 	542
540 	570
541 	593
542 	551
543 	588

【0670】

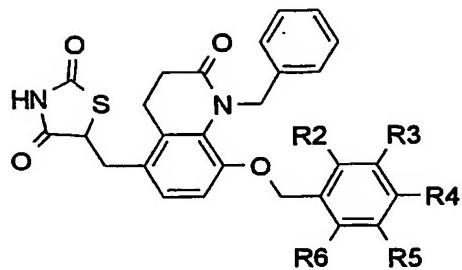
【表85】



実施例 R1	MS(M+1)
544	552
545	566

【0671】

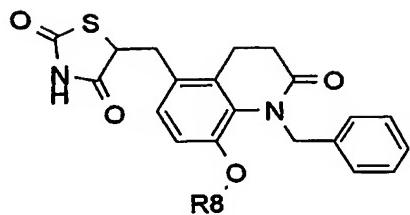
【表86】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
546	-H	-H	-Cl	-H	-H	507
547	-Cl	-H	-H	-H	-H	507
548	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	541
549	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	541
550	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	487
551	-H	-F	-H	-H	-H	491
552	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	487
553	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	529
554	-H	-Cl	-H	-H	-H	507
555	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	503
556	-H	-H	-H	-NO ₂	-H	518
557	-H	-H	-SO ₂ CH ₃	-H	-H	551
558	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	503
559	-H	-H	-CH=CHC ₆ H ₅ (trans)	-H	-H	575
560	-H	-H	-OCOCH ₃	-H	-H	531
561	-H	-H	-F	-H	-H	491
562	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	503
563	-H	-H		-H	-H	557
564	-H	-H	-SCF ₃	-H	-H	573

【0672】

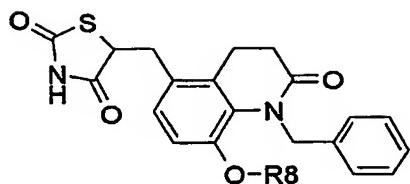
【表87】



実施例 R8	MS(M+1)
565 -CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	454
566 -CH ₂ CH=CHCH ₃ (trans)	437
567 -(CH ₂) ₃ CH=CH ₂	451
568 -(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	487
569 -CH ₂ CCCH ₃	435
570 -CH ₂ CCC ₆ H ₅	497
571 -CH ₂ CH(CH ₃) ₂	439
572 -CH ₂ COCH ₃	439
573 -(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	468
574 -(CH ₂) ₂ SC ₆ H ₅	519
575 -CH ₂ CCH	421
576 -CH ₂ CH=CHC ₆ H ₅	499
577 -CH ₂ CON(CH ₃) ₂	468
578 -CH ₂ COC ₆ H ₅	501
579 -CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	469
580 -(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	503
581 -(CH ₂) ₂ OCH ₂ C ₆ H ₅	517
582 -(CH ₂) ₄ COC ₆ H ₅	543
583 -(CH ₂) ₃ OCH ₂ C ₆ H ₅	531

【0673】

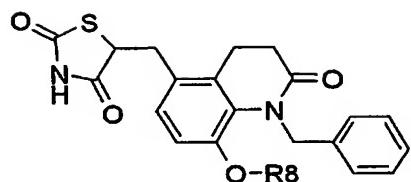
【表88】



実施例 R8	MS(M+1)
584	494
585	488
586	535
587	555
588	597
589	492
590	555
591	474
592	556
593	474

【0674】

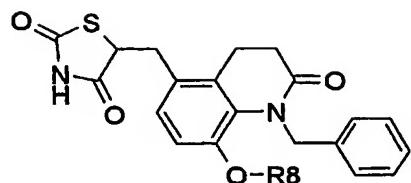
【表 8 9】



実施例 R8	MS(M+1)
594	494
595	604
596	541
597	604
598	493
599	561
600	542
601	502
602	553

【0675】

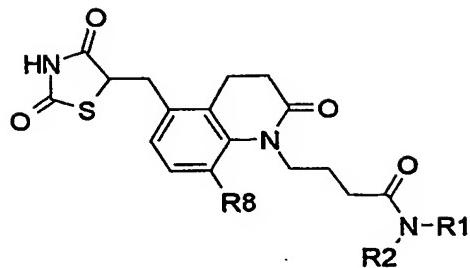
【表90】



実施例 R8	MS(M+1)
603	479
604	463
605	499
606	570

【0676】

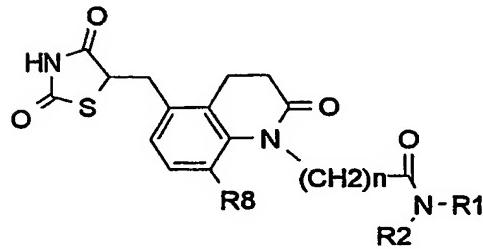
【表91】



実施例	R1	R2	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
607	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	-OCH ₃	0.94 (3H, t, J = 7.1 Hz), 0.99 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.50-1.69 (2H, m), 2.08 (2H, t, J = 7.7 Hz), 2.26-2.45 (2H, m), 2.63-2.85 (2H, m), 2.99-3.22 (5H, m), 3.31-3.49 (1H, m), 3.79 (3H, s), 3.82-4.03 (2H, m), 4.78 (1H, dd, J = 4.2, 10.0 Hz), 6.83-7.06 (2H, m), 12.08 (1H, brs).
608	-H	-C ₆ H ₅	-OCH ₃	1.64-1.81 (2H, m), 2.20 (2H, t, J = 7.4 Hz), 2.30-2.46 (2H, m), 2.63-2.92 (2H, m), 2.99-2.16 (1H, m), 2.35-2.50 (1H, m), 3.78 (3H, s), 3.86-4.02 (2H, m), 4.69-4.85 (1H, m), 6.87-7.07 (3H, m), 7.18-7.32 (2H, m), 7.54 (2H, d, J = 7.6 Hz), 9.80 (1H, s), 12.07 (1H, s).
609	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-OCH ₃	0.95-1.32 (5H, m), 1.42-1.75 (7H, m), 1.83-2.00 (2H, m), 2.25-2.45 (2H, m), 2.64-2.89 (2H, m), 3.00-3.15 (1H, m), 3.35-3.52 (2H, m), 3.79 (3H, s), 3.80-3.95 (2H, m), 4.77 (1H, dd, J = 4.2, 10.0 Hz), 6.81-7.05 (2H, m), 7.56 (1H, d, J = 7.8 Hz), 12.07 (1H, brs).

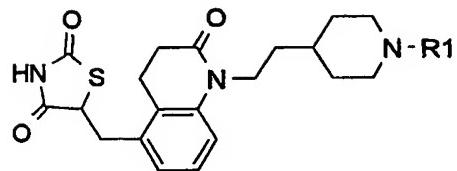
【0677】

【表92】



実施例	n	R1	R2	R8	融点(°C)
610	1	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-OCH ₃	105-114
611	1	-H	-C ₆ H ₅	-OCH ₃	135-138.5
612	1	-H		-OCH ₃	128-132.5
613	3	-H	-C ₂ H ₅	-OCH ₃	174.2-175.2

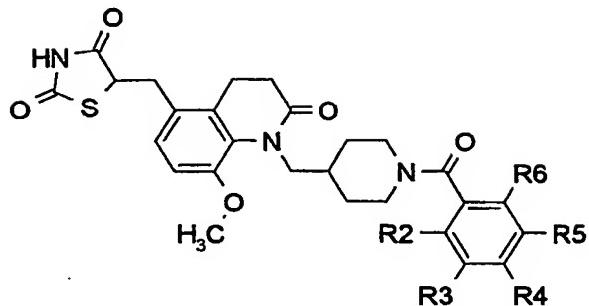
【0678】
【表93】



実施例	R1	融点(°C)
614	-COCH ₃	209.5-211
615		120-122
616		182-184.5
617	-COC ₃ H ₇	52-67
618		53-69

【0679】

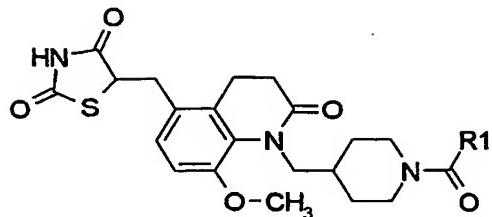
【表94】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
619	-H	-H	-H	-H	-H	508
620	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	522
621	-H	-H	-Cl	-H	-H	542
622	-H	-H	-F	-H	-H	526
623	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	538
624	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	576
625	-Cl	-H	-H	-H	-H	542
626	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	522
627	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	538
628	-H	-Cl	-H	-H	-H	542
629	-H	-CN	-H	-H	-H	533
630	-Cl	-Cl	-H	-H	-H	576
631	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	576
632	-Cl	-H	-F	-H	-H	560
633	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	-H	600
634	-OCH ₃	-H	-H	-Cl	-H	572
635	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	576
636	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	592
637	-Br	-H	-H	-H	-H	588
638	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	592
639	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	592
640	-H	-H	-CN	-H	-H	533
641	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	564
642	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	566
643	-H	-Br	-H	-H	-H	586
644	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	576
645	-H	-H		-H	-H	574

【0680】

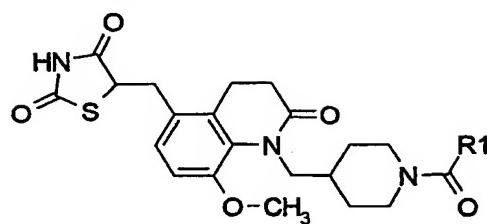
【表95】



実施例	R1	MS(M+1)
646	-CH=CHC ₆ H ₅ (trans)	534
647	-2-PYRIDYL	509
648	-3-PYRIDYL	509
649	-4-PYRIDYL	509
650	-2-FURYL	498
651	-2-THIENYL	514
652	-3-FURYL	498
653	-3-THIENYL	514
654	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	528
655	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	536
656	-OC ₆ H ₅	524
657	-OCH ₂ C ₆ H ₅	538
658	-OC ₄ H ₉	504
659	-cyclo-C ₆ H ₁₁	514
660	-cyclo-C ₃ H ₅	472
661	-cyclo-C ₄ H ₇	486
662	-CH ₂ OC ₆ H ₅	538
663	-CH(C ₂ H ₅)C ₄ H ₉	530
664	-N(C ₂ H ₅) ₂	503
665	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	506
666	-OCH ₂ CCH	486
667	-O(CH ₂) ₄ Cl	538

【0681】

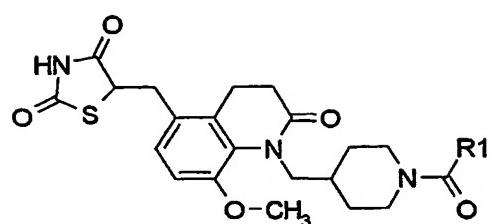
【表96】



実施例 R1	MS(M+1)
668	556
669	572
670	557
671	543
672	577
673	543
674	515
675	577
676	516
677	558

【0682】

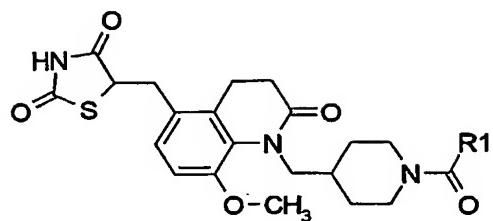
【表97】



実施例 R1	MS(M+1)
678	547
679	548
680	564
681	558
682	554
683	574
684	542
685	538
686	572
687	552

【0683】

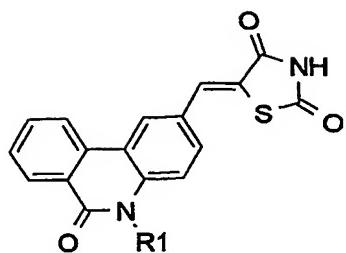
【表98】



実施例 R1	MS(M+1)
688	 560
689	 598
690	 560
691	 517
692	 537
693	 515
694	 501

【0684】

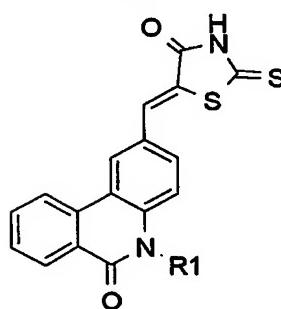
【表99】



実施例 R1	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
695 -CH ₂ C ₆ H ₅	5.67(2H, s), 7.0-8.0(10H, m), 8.45(1H, dd, J=8.0Hz, 1.3Hz), 8.60(1H, d, J=8.0Hz), 8.80(1H, d, J=1.8Hz), 12.6(1H, br s)
696 -C ₂ H ₅	1.29(3H, t, J=7.1Hz), 4.41(2H, t, J=7.1Hz), 7.6-8.0(5H, m), 8.38(1H, dd, J=8.0Hz, 1.2Hz), 8.56(1H, d, J=8.1Hz), 8.74(1H, s), 12.6(1H, br s)

【0685】

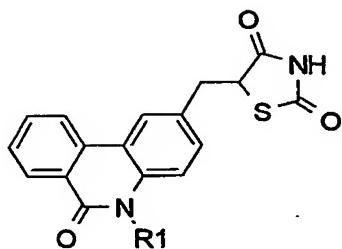
【表100】



実施例 R1	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
697 -CH ₂ C ₆ H ₅	5.67(2H, s), 7.1-8.1(10H, m), 8.55(1H, dd, J=8.0Hz, 1.3Hz), 8.65(1H, d, J=8.0Hz), 8.81(1H, d, J=1.8Hz), 13.8(1H, br s)
698 -C ₂ H ₅	1.30(3H, t, J=7.1Hz), 4.41(2H, t, J=7.1Hz), 7.5-8.0(5H, m), 8.38(1H, dd, J=8.0Hz, 1.2Hz), 8.55(1H, d, J=8.1Hz), 8.79(1H, s), 13.9(1H, br s)
699	5.72(2H, s), 7.1-8.0(14H, m), 8.46(1H, dd, J=8.0Hz, 1.3Hz), 8.62(1H, d, J=8.0Hz), 8.82(1H, d, J=1.8Hz), 13.5(1H, br s)

【0686】

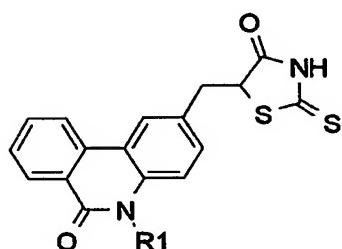
【表101】



実施例	R1	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
700	-CH ₂ C ₆ H ₅	3.1-3.7(2H, m), 5.04(1H, dd, J=13.8Hz, 4.8Hz), 5.76(2H, s), 7.1-7.45(7H, m), 7.6-8.0(2H, m), 8.3-8.6(3H, m), 12.0(1H, br s)
701	-C ₂ H ₅	1.27(3H, t, J=7.1Hz), 3.2-3.7(2H, m), 4.39(2H, t, J=7.1Hz), 5.09(1H, dd, J=13.8Hz, 4.8Hz), 7.4-7.9(4H, m), 8.25-8.6(3H, m), 12.2(1H, br s)

【0687】

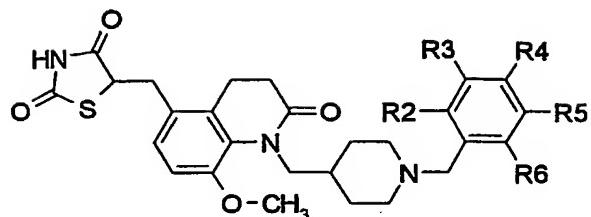
【表102】



実施例	R1	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
702	-CH ₂ C ₆ H ₅	3.1-3.7(2H, m), 5.16(1H, dd, J=13.8Hz, 4.8Hz), 5.63(2H, s), 7.0-7.45(7H, m), 7.6-8.0(2H, m), 8.3-8.6(3H, m), 13.2(1H, br s)
703		3.1-3.7(2H, m), 5.16(1H, dd, J=13.8Hz, 4.8Hz), 5.69(2H, s), 7.1-8.0(13H, m), 8.4-8.7(3H, m), 13.2(1H, br s)
704	-C ₂ H ₅	1.27(3H, t, J=7.1Hz), 3.2-3.7(2H, m), 4.39(2H, t, J=7.1Hz), 5.20(1H, dd, J=13.8Hz, 4.8Hz), 7.4-7.9(4H, m), 8.35-8.6(3H, m), 13.2(1H, br s)

【0688】

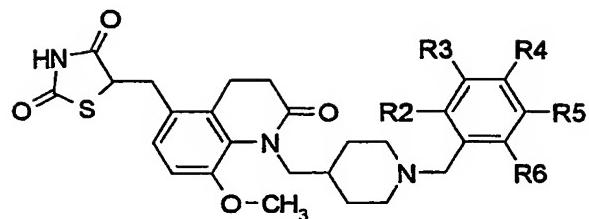
【表103】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
705	-H	-H	-H	-H	-H	494
706	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	524
707	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	524
708	-H	-H	-CN	-H	-H	519
709	-H	-H	-N(C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	565
710	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	551
711	-Cl	-H	-H	-H	-H	528
712	-H	-Cl	-H	-H	-H	528
713	-H	-H	-Cl	-H	-H	528
714	-F	-H	-H	-H	-H	512
715	-CN	-H	-H	-H	-H	519
716	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	562
717	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	562
718	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	508
719	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	562
720	-H	-H	-Br	-H	-H	574
721	-H	-H	-F	-H	-H	512
722	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	508
723	-H	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-H	566
724	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	552
725	-H	-F	-H	-H	-H	512
726	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	537
727	-H	-H	-OCOCH ₃	-H	-H	552
728	-H	-H	-C ₄ H ₉	-H	-H	550
729	-H	-H	-SO ₂ CH ₃	-H	-H	572
730	-H	-H	-SC ₂ H ₅	-H	-H	554
731	-H	-H	-OCHF ₂	-H	-H	560
732	-H	-H		-H	-H	563

【0689】

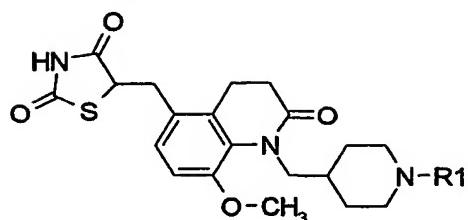
【表104】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
733	-H	-H	-OC(CH ₃) ₃	-H	-H	566
734	-H	-H	-H	-H	-H	508
735	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	538
736	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	538
737	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	538
738	-H	-H	-H	-H	-Cl	542
739	-H	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-H	580

【0690】

【表105】

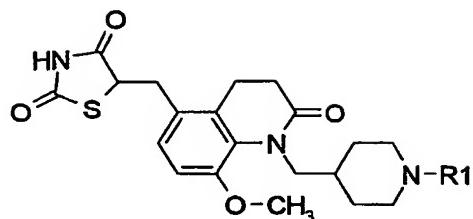


実施例 R1	MS(M+1)
740 -CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	500
741 -C ₆ H ₁₃	488
742 -cyclo-C ₆ H ₁₁	486
743	484
744	495
745	495
746	495
747	500
748	500
749	501
750	534
751	498

【0691】

出証特2005-3094054

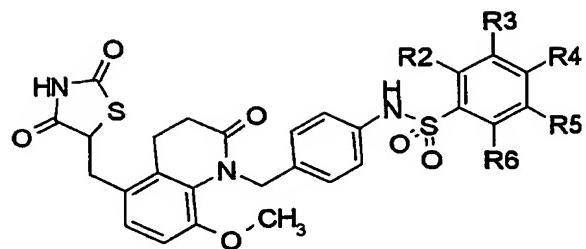
【表106】



実施例 R1	MS(M+1)
752	497
753	484
754	573
755	563
756	529
757	488
758	532
759	504

【0692】

【表107】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
760	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	582
761	-H	-H	-Cl	-H	-H	586
762	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	566
763	-H	-H	-F	-H	-H	570
764	-OCH ₃	-H	-H	-Cl	-H	616
765	-H	-H	-H	-H	-CF ₃	620
766	-H	-H	-H	-H	-Cl	586
767	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	636
768	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	610
769	-CN	-H	-H	-H	-H	577
770	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	582
771	-H	-H	-H	-F	-H	570
772	-H	-H	-H	-H	-F	570
773	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	620
774	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	620
775	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	636
776	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	612
777	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	612
778	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	566
779	-H	-H	-H	-H	-NO ₂	597
780	-H	-H	-H	-NO ₂	-H	597
781	-H	-H	-Br	-H	-H	632
782	-H	-H	-H	-Cl	-H	586
783	-H	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	596
784	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	620
785	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	636
786	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	620
787	-Cl	-H	-H	-Cl	-H	620
788	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	620
789	-H	-H	-CH ₃	-NO ₂	-H	611
790	-H	-H	-F	-H	-Cl	604
791	-H	-CH ₃	-Cl	-H	-Cl	634

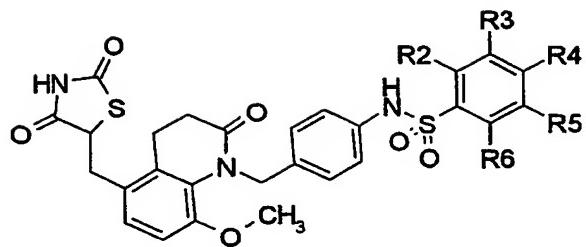
特願2004-282814

ページ： 224/

【0693】

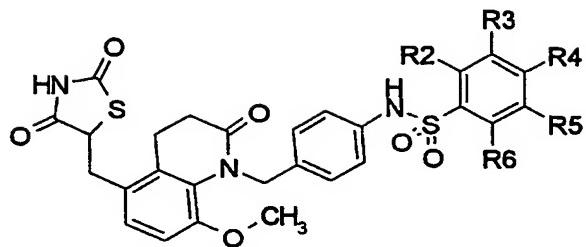
出証特2005-3094054

【表108】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
792	-CH ₃	-H	-H	-NO ₂	-H	611
793	-Cl	-H	-H	-NO ₂	-H	631
794	-H	-H	-CN	-H	-Cl	611
795	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	594
796	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	609
797	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	597
798	-H	-Cl	-H	-Cl	-OH	636
799	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	566
800	-H	-H	-OCH ₃	-H	-NO ₂	627
801	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	620
802	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	608
803	-H	-H	-H	-CO ₂ H	-H	596
804	-Br	-H	-H	-Cl	-H	666
805	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	-H	580
806	-H	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	580
807	-H	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-H	624
808	-F	-H	-H	-F	-H	588
809	-H	-H	-H	-CN	-H	577
810	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-Cl	634
811	-H	-F	-H	-Cl	-CH ₃	618
812	-H	-H	-Br	-H	-CH ₃	646
813	-H	-H	-H	-Br	-H	632
814	-H	-H	-CN	-H	-H	577
815	-H	-H	-NHCOCH ₃	-Cl	-H	643
816	-H	-H	-F	-H	-F	588
817	-H	-H	-CH ₃	-H	-OCH ₃	596
818	-H	-H	-H	-Cl	-CH ₃	600
819	-F	-H	-H	-H	-F	588
820	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	584
821	-CH ₃	-H	-Cl	-CH ₃	-H	614
822	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	600
823	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	594

【0694】
【表109】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
824	-H	-H	-F	-Cl	-H	604
825	-H	-H	-Br	-H	-F	650
826	-H	-H	-CH ₃	-Cl	-H	600
827	-H	-H	-F	-F	-H	588
828	-H	-H	-H	-H	-Br	632
829	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	620
830	-H	-H	-(CH ₂) ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	638
831	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	624
832	-H	-H	-OH	-CO ₂ H	-H	612
833	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-H	596
834	-F	-H	-F	-F	-H	606
835	-H	-H	-H	-H	-H	552

【0695】

【表110】



実施例 R1	MS(M+1)
836 -2-THIENYL	558
837 -C ₄ H ₉	532
838 -CH=CH ₂	502
839 -(CH ₂) ₃ Cl	552
840 -CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	572
841 -CH ₂ CF ₃	558
842 -CH ₂ C ₆ H ₅	566
843 -CH=CHC ₆ H ₅ (trans)	578
844	603
845	556
846	610
847	592
848	623
849	604
850	571

【0696】

出証特2005-3094054

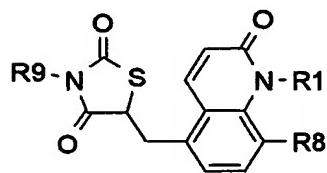
【表111】



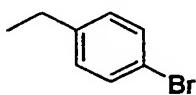
実施例 R1	MS(M+1)
851	
852	
853	
854	
855	

【0697】

【表112】

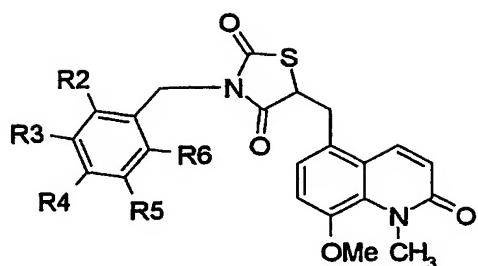


実施例 R1	R8	R9	融点(°C)
856 -CH ₃	-OCH ₃	-H	254-255
857 -CH ₃	-OCH ₃	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	182-184
858 -CH ₃	-OCH ₃	-CH ₂ CO ₂ H	207-210
859 -(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	-OCH ₃	-H	141-145
860	-OCH ₃	-H	247.9-251.8



【0698】

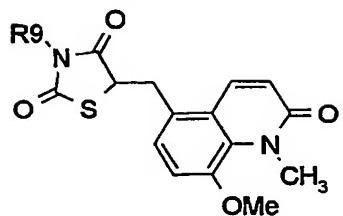
【表113】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
861	-H	-H	-Cl	-H	-H	443
862	-H	-H	-H	-H	-Cl	443
863	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	477
864	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	423
865	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	485
866	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	465
867	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	477
868	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	423
869	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	485
870	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	493
871	-H	-H	-H	-F	-H	427
872	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	423
873	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	493
874	-H	-H	-H	-Cl	-H	443
875	-H	-H	-F	-H	-H	427
876	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	439
877	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	439
878	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	467
879	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	501
880	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	465
881	-H	-H	-H	-H	-H	409
882	-H	-H	-SO ₂ CH ₃	-H	-H	487
883	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	493
884	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	515
885	-H	-H	-OCH ₃	-Cl	-H	473
886	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	439
887	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	466

【0699】

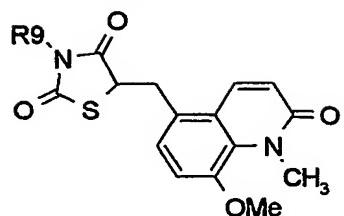
【表114】



実施例	R9	MS(M+1)
888	-CH ₂ C≡CH	357
889	-CH ₂ CH=CH ₂	359
890	-CH ₂ CH=CHC ₆ H ₅	435
891	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	423
892	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	437
893	-CH ₃	333
894	-C ₂ H ₅	347
895	-CH(CH ₃) ₂	361
896	-C ₄ H ₉	375
897	-CH ₂ CH ₂ OH	363
898	-C ₆ H ₁₃	403
899	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	415
900	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	405
901		459
902		460
903		471
904		430
905		429
906		499

【0700】

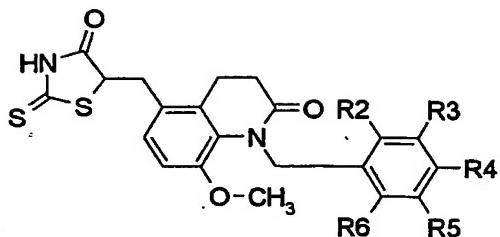
【表115】



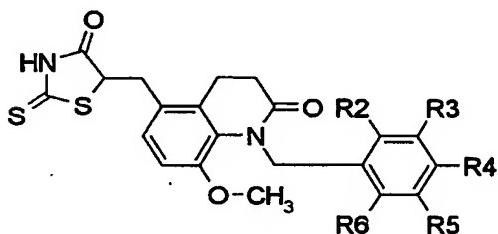
実施例 R9	MS(M+1)
907	459
908	449
909	466
910	410
911	560
912	489

【0701】

【表116】



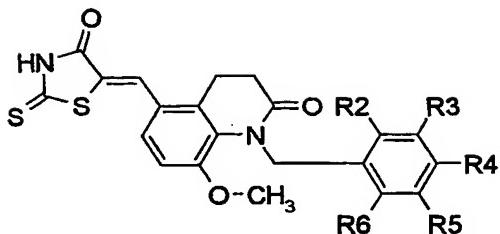
実施例	R2	R3	R4	R5	R6	融点(°C)
913	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	164-168
914	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	222-224
915	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	193-199
916	-H	-H	-Cl	-H	-H	179.8-183.8
917	-H	-H	-Br	-H	-H	191.3-192.1
918	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	156.5-158.5



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
919	-H	-H	-H	-H	-H	2.45-2.54(m, 2H), 2.75-2.85(m, 2H), 3.13(dd; J=9.5, 14.4Hz, 1H), 3.38(dd; J=4.7, 14.4Hz, 1H), 3.67(s, 3H), 4.92(dd; J=4.7, 9.5Hz, 1H), 5.19(s, 2H), 6.81(d, J=8.6Hz, 1H), 6.89(d, J=8.6Hz, 1H), 7.04(d, J=7.5Hz, 2H), 7.11(t, J=7.5Hz, 1H), 7.19(t, J=7.5Hz, 2H), 13.19(brs, 1H)
920	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	2.47-2.57(m, 2H), 2.80-2.88(m, 2H), 3.15(dd; J=9.9, 14.5Hz, 1H), 3.40(dd; J=4.5, 14.5Hz, 1H), 3.69(s, 3H), 4.91(dd; J=4.5, 9.9Hz, 1H), 5.26(s, 2H), 6.84(d, J=8.6Hz, 1H), 6.91(d, J=8.6Hz, 1H), 7.02(d, J=7.7Hz, 1H), 7.24-7.57(m, 8H), 13.22(brs, 1H)

【0702】

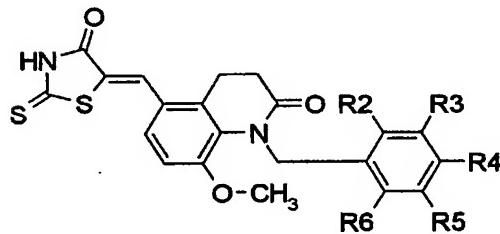
【表117】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
921	-H	-H	-H	-H	-H	2.56(2H, t, J=6.9Hz), 2.97(2H, t, J=6.9Hz), 3.78(3H, s), 5.21(2H, s), 7.0-7.55(7H, m), 7.69(1H, s), 13.80(1H, br s)
922	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	2.58(2H, t, J=6.9Hz), 3.00(2H, t, J=6.9Hz), 3.81(3H, s), 5.24(2H, s), 7.0-7.6(11H, m), 7.80(1H, s), 13.85(1H, br s)
923	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	1.20(9H, s), 2.54(2H, t, J=6.9Hz), 2.96(2H, t, J=6.9Hz), 3.81(3H, s), 5.20(2H, s), 7.00(2H, d, J=8.2Hz), 7.07(1H, d, J=8.8Hz), 7.15(1H, d, J=8.8Hz), 7.22(2H, d, J=8.2Hz), 7.69(1H, s), 13.8(1H, br s)

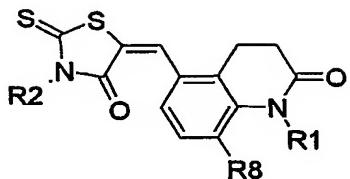
【0703】

【表118】



実施例	R2	R3	R4	R5	R6	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
924	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	2.57(2H, t, J=6.9Hz), 3.00(2H, t, J=6.9Hz), 3.79(3H, s), 5.27(2H, s), 7.0-7.55(11H, m), 7.71(1H, s), 13.7(1H, br s)
925	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	2.49(2H, t, J=6.9Hz), 2.80(2H, t, J=6.9Hz), 3.44(3H, s), 5.20(2H, s), 6.91(1H, d, J=8.6Hz), 7.05-7.5(10H, m), 7.66(1H, s), 13.8(1H, br s)
926	-H	-H	-Cl	-H	-H	2.49-2.56 (2H, m), 2.84-3.08 (2H, m), 3.74 (3H, s), 5.14 (2H, s), 6.95-7.20 (4H, m), 7.20-7.33 (2H, m), 7.69 (1H, s), 13.79 (1H, brs).
927	-H	-H	-Br	-H	-H	2.51-2.62 (2H, m), 2.86-3.05 (2H, m), 3.74 (3H, s), 5.11 (2H, s), 6.98-7.10 (3H, m), 7.16 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.40 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.69 (1H, s), 13.79 (1H, s).
928	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	2.42-2.61 (2H, m), 2.85-2.05 (2H, m), 3.80 (3H, s), 5.17 (2H, s), 6.84 (2H, d, J = 8.6 Hz), 6.91 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.05-7.17 (5H, m), 7.32-7.37 (2H, m), 7.69 (1H, s), 13.78 (1H, brs).

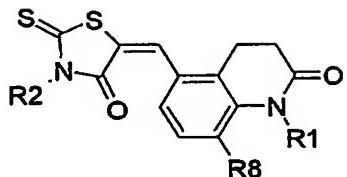
【0704】
【表119】



実施例	R1	R2	R8	* ¹ H NMR δ ppm
929	-CH ₃	-H	-OCH ₃	2.43(2H, t, J=6.9Hz), 2.91(2H, t, J=6.9Hz), 3.20(3H, s), 3.89(3H, s), 7.17(1H, d, J=8.8Hz), 7.20(1H, d, J=8.8Hz), 7.68(1H, s)
930	-H	-H	-OCH ₃	2.48(2H, t, J=6.9Hz), 3.00(2H, t, J=6.9Hz), 3.85(3H, s), 6.95-7.2(2H, m), 9.22(1H, s), 13.77(1H, br s)
931	-CH ₃	-CH ₃	-OCH ₃	CDCl ₃ : 2.5-2.6(2H, m), 2.95-3.0(2H, m), 3.37(3H, s), 3.53(3H, s), 3.93(3H, s), 6.95(1H, d, J=8.8Hz), 7.24(1H, d, J=8.8Hz), 7.89(1H, s)
932	-C ₄ H ₉	-H	-OCH ₃	0.81(3H, t, J=7.3Hz), 1.1-1.2(2H, m), 1.3-1.4(2H, m), 2.44(1H, t, J=6.9Hz), 2.90(2H, t, J=6.9Hz), 3.90(3H, s), 3.92(2H, t, J=7.3Hz), 7.18(1H, d, J=8.8Hz), 7.22(1H, d, J=8.8Hz), 7.71(1H, s), 13.81(1H, br s)
933	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	-H	-OCH ₃	1.65-1.8(2H, m), 2.35-2.5(4H, m), 2.92(2H, t, J=6.9Hz), 3.80(3H, s), 3.91(2H, t, J=7.3Hz), 7.0-7.3(7H, m), 7.72(1H, s), 13.8(1H, br s)
934	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-H	-OCH ₃	2.36(2H, t, J=6.9Hz), 2.59(2H, t, J=4.5Hz), 2.73(2H, t, J=6.9Hz), 3.96(3H, s), 4.17(2H, t, J=4.5Hz), 7.00(1H, d, J=8.8Hz), 7.1-7.3(5H, m), 7.64(1H, s), 13.82(1H, br s)
935	-C ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	1.07(3H, t, J=7.0Hz), 2.42(2H, t, J=6.9Hz), 2.92(2H, t, J=6.9Hz), 3.86(2H, q, J=7.0Hz), 3.91(3H, s), 7.19(1H, d, J=8.8Hz), 7.22(1H, d, J=8.8Hz), 7.71(1H, s), 12.82(1H, br s)
936	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-H	-OCH ₃	2.47(2H, t, J=6.9Hz), 2.88(2H, t, J=6.9Hz), 3.88(3H, s), 4.06(2H, t, J=5.9Hz), 4.29(2H, t, J=5.9Hz), 6.77(2H, d, J=8.6Hz), 6.88(1H, t, J=8.6Hz), 7.1-7.3(4H, m), 7.68(1H, s), 13.8(1H, br s)
937	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	-OCH ₃	0.75-1.57(11H, m), 2.45(2H, t, J=6.9Hz), 2.92(2H, t, J=6.9Hz), 3.91(3H, s), 3.95-4.00(2H, m), 7.18(1H, d, J=8.8Hz), 7.23(1H, d, J=8.8Hz), 7.73(1H, s), 13.8(1H, br s)

*記載の無い場合測定溶媒 DMSO-d6

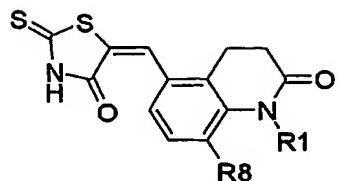
【表120】



実施例	R1	R2	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
938	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	-OCH ₃	2.50(2H, t, J=6.9Hz), 2.89(2H, t, J=6.9Hz), 3.10(3H, s), 3.35(2H, t, J=6.0Hz), 3.90(3H, s), 4.10(2H, t, J=6.0Hz), , 7.17(2H, d, J=8.6Hz), 7.24(1H, t, J=8.6Hz), 7.71(1H, s), 13.8(1H, br s)
939	-CH(C ₆ H ₅) ₂	-H	-OCH ₃	2.4-2.5(2H, m), 2.8-2.95(2H, m), 3.41(3H, s), 6.29(2H, s), 6.95-7.35(12H, m), 7.73(1H, s), 13.8(1H, br s)
940	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	-H	-OCH ₃	0.05-0.10(2H, m), 0.25-0.30(2H, m), 0.75-0.80(1H, m), 2.46(2H, t, J=6.9Hz), 2.93(2H, t, J=6.9Hz), 3.85-3.95(5H, m), 7.1-7.3(2H, m), 7.73(1H, s), 13.82(1H, br s)
941	-C ₆ H ₅	-H	-H	2.71-2.76 (2H, m), 3.13-3.18 (2H, m), 6.32 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.10 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.19-7.27 (3H, m), 7.43-7.56 (3H, m), 7.83 (1H, s), 13.85 (1H, brs).
942	-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	-H	-OCH ₃	1.35-1.50(4H, m), 2.40-2.70(4H, m), 2.89(2H, t, J=6.9Hz), 3.83(3H, s), 3.85-3.95(2H, m), 7.05-7.3(7H, m), 7.71(1H, s), 13.8(1H, br s)
943	-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	-H	-OCH ₃	1.05-1.15(2H, m), 1.35-1.5(4H, m), 2.35-2.70(4H, m), 2.80(2H, t, J=6.9Hz), 3.85-4.0(5H, m), 7.05-7.3(7H, m), 7.69(1H, s), 13.82(1H, br s)

【0706】

【表121】

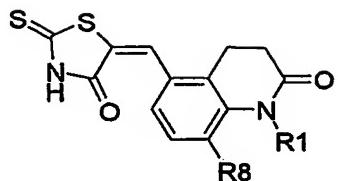


実施例 R1	R8	*1H NMR δ ppm
944	-OCH ₃	2.61(2H, t, J=6.9Hz), 2.87(2H, t, J=6.9Hz), 3.71(3H, s), 5.64(2H, s), 7.0-8.05(10H, m), 13.8(1H, br s)
945	-OCH ₃	2.60(2H, t, J=6.9Hz), 3.02(2H, t, J=6.9Hz), 3.77(3H, s), 5.37(2H, s), 6.95-7.85(10H, m), 13.8(1H, br s)
946	-OC ₄ H ₉	0.82(3H, t, J=7.4Hz), 1.2-1.35(2H, m), 1.45-1.6(2H, m), 2.59(2H, t, J=6.9Hz), 3.01(2H, t, J=6.9Hz), 4.01(2H, t, J=6.4Hz), 5.21(2H, s), 7.0-7.65(11H, m), 7.71(1H, s), 13.8(1H, br s)
947	-OCH ₂ CO ₂ C(CH ₃) ₃	CDCl ₃ : 1.54(9H, s), 2.68(2H, t, J=6.8Hz), 2.98(2H, t, J=6.8Hz), 4.46(2H, s), 5.47(2H, s), 6.69(1H, d, J=8.5Hz), 7.1-7.6(10H, m), 7.78(1H, s), 9.25(1H, br s)
948	-OH	2.57(2H, t, J=6.9Hz), 2.97(2H, t, J=6.9Hz), 5.35(2H, s), 6.8-7.65(11H, m), 7.69(1H, s), 10.92(1H, s), 13.8(1H, br s)
949	-H	2.64-2.82 (2H, m), 3.07 (2H, t, J = 7.8 Hz), 5.21 (2H, brs), 7.00-7.13 (2H, m), 7.24-7.49 (6H, m), 7.54-7.70 (4H, m), 7.79 (1H, s), 13.82 (1H, s).
950	-H	2.64-2.80 (2H, m), 2.97-3.12 (2H, m), 5.13 (2H, s), 7.01 (1H, d, J = 8.1. Hz), 7.08 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.11-7.35 (3H, m), 7.44-7.55 (2H, m), 7.78 (1H, s), 13.84 (1H, s).

*記載の無い場合測定溶媒 DMSO-d6

【0707】

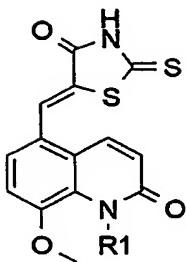
【表 122】



実施例 R1	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
951	-H	2.20-2.37 (2H, m), 2.49-2.69 (2H, m), 4.83 (2H, s), 6.49-6.62 (2H, m), 6.68-6.82 (1H, m), 6.87-7.05 (3H, m), 7.21 (1H, s), 7.25-7.49 (4H, m), 13.36 (1H, s).
952	-OCH ₃	2.58-2.61 (2H, m), 2.98-3.01 (2H, m), 3.77 (3H, s), 5.17 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=8.9Hz), 7.16 (1H, d, J=8.9Hz), 7.53-7.74 (5H, m), 8.09-8.10 (1H, m), 8.35 (1H, d, J=2.0Hz), 13.79 (1H, brs)
953	-H	2.65-2.80 (2H, m), 2.99-3.12 (2H, m), 5.16 (2H, s), 7.03 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.09 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.20-7.40 (5H, m), 7.79 (1H, s), 13.87 (1H, brs).
954	-H	2.24 (3H, s), 2.68-2.73 (2H, m), 3.01-3.07 (2H, m), 5.12 (2H, s), 7.02-7.18 (6H, m), 7.26 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.78 (1H, s), 13.86 (1H, brs).
955	-OCH ₃	2.61-2.66 (2H, m), 3.16-3.21 (2H, m), 3.64 (3H, s), 5.33 (2H,s), 7.07 (1H, d, J=8.8Hz), 7.17 (1H, d, J=8.8Hz), 7.39 (1H, d, J=8.6Hz), 7.50-7.561 (1H, m), 7.67-7.73 (1H, m), 7.78 (1H, s), 7.87-7.93 (2H, m), 8.24 (1H, d, J=8.5Hz), 13.80 (1H, brs)
956	-OCH ₃	2.47-2.52 (2H, m), 2.88-2.93 (2H, m), 3.30 (3H, s), 3.86 (3H, s), 5.11 (2H,s), 6.38 (1H, d, J=8.7Hz), 7.06-7.22 (6H, m), 7.35-7.41 (2H, m), 7.67 (1H, s), 7.89 (1H, d, J=2.1Hz), 13.75 (1H, brs)
957	-H	2.70-2.76 (2H, m), 3.03-3.09 (2H, m), 5.21 (2H,s), 7.07-7.12 (2H, m), 7.32 (1H, t, J=8.0Hz), 7.45 (1H, d, J=8.3Hz), 7.69 (1H, dd, J1=2.4Hz, J2=8.3Hz), 7.78 (1H, s), 8.36 (1H, d, J=2.4Hz), 13.81 (1H, brs)

【0708】

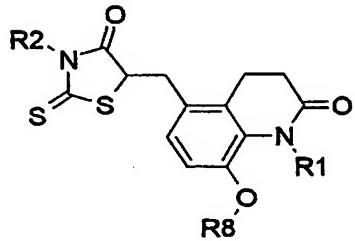
【表123】



実施例 R1	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
958 -CH ₃	4.02(3H, s), 4.07(3H, s), 6.77(1H, d, J=9.8Hz), 7.35-7.65(2H, m), 8.07(1H, s), 8.17(1H, d, J=9.8Hz),
959	3.66 (3H, s), 5.67 (2H, s), 6.82 (1H, d, J = 9.8 Hz), 7.04 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.28-7.38 (2H, m), 7.40-7.52 (2H, m), 8.05 (1H, s), 8.22 (1H, d, J = 10.0 Hz), 13.86 (1H, brs).

【0709】

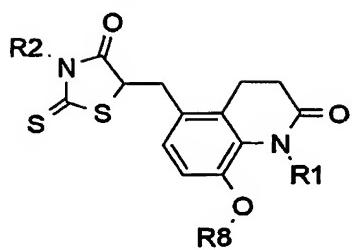
【表124】



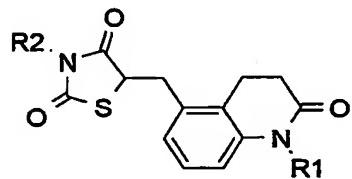
実施例 R1	R2	R8	融点(°C)
960 -CH ₃	-H	-CH ₃	204-209
961 -H	-H	-CH ₃	266(dec.)
962 -CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	196-198
963 -C ₂ H ₅	-H	-CH ₃	200.5-201.5
964 -CH(C ₆ H ₅) ₂	-H	-CH ₃	233(dec.)
965 -(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	139.5-141
966 -C ₃ H ₇	-H	-CH ₃	59-83
967 -C ₅ H ₁₁	-H	-CH ₃	143-145.5
968 -CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	182-184
969 -CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	208-211

【0710】

【表125】



実施例 R1	R2	R8	融点(°C)
970	-H	-CH ₃	238(分解)
971	-H	-CH ₃	133-136
972	-H	-C ₄ H ₉	156-161
973	-H	-CH ₂ CO ₂ H	128-135
974	-H	-CH ₃	177-181

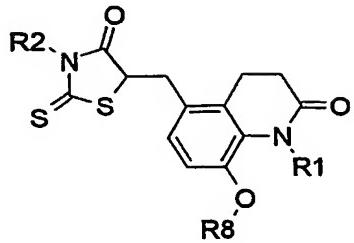


実施例 R1	R2	1H NMR δ ppm
975 CH ₃ OCH ₂ O(CH ₂) ₃ -	-H	CDCl ₃ :1.9-2.0(2H, m), 2.63(2H, t, J=7.1Hz), 2.75-3.05(2H, m), 3.16(1H, dd, J=13.3Hz, J=4.0Hz), 3.37(3H, s), 3.60(2H, t, J=6.2Hz), 3.6-3.75(1H, m), 4.0-4.2(2H, m), 4.48(1H, dd, J=10.3Hz, J=4.0Hz), 4.69(3H, s), 6.94(1H, d, J=7.6Hz), 7.08(1H, d, J=8.2Hz)...
976 HO(CH ₂) ₃ -	-H	DMSO:1.6-1.9(2H, m), 2.7-3.0(2H, m), 3.13(1H, dd, J=14.4Hz, J=4.0Hz), 3.3-3.8(5H, m), 3.91(2H, t, J=8.4Hz), 4.55(1H, t, J=5.0Hz), 4.83(1H, dd, J=14.4Hz, J=4.0Hz), 6.92(1H, d, J=7.5Hz), 7.0-7.5(2H, m), 12.13(1H, br s)

【0711】

出証特2005-3094054

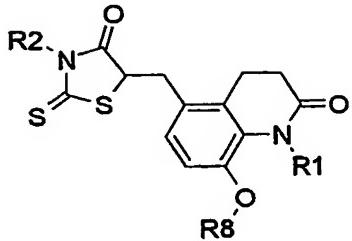
【表 126】



実施例	R1	R2	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
977	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	-H	-CH ₃	1.64-1.73(m, 2H), 2.32-2.42(m, 4H), 2.74-2.85(m, 2H), 3.10(dd; J=9.8, 14.4Hz, 1H), 3.14(dd; J=4.6, 14.4Hz, 1H), 3.69(S, 3H), 3.85-3.95(m, 2H), 4.93(dd; J=4.6, 9.8Hz, 1H), 6.93(d, J=8.6Hz, 1H), 6.98(d, J=8.6Hz, 1H), 7.04(d, J=7.5Hz, 2H), 7.14(t, J=7.5Hz, 1H), 7.23(t, J=7.5Hz, 2H), 13.22(brs, 1H)
978	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-H	-CH ₃	2.22-2.31(m, 2H), 2.32-2.55(m, 2H), 2.63-2.75(m, 2H), 3.12(dd; J=10.0, 14.4Hz, 1H), 3.68(dd; J=4.5, 14.4Hz, 1H), 3.87(S, 3H), 4.10-4.30(m, 2H), 4.83(dd; J=4.5, 10.0Hz, 1H), 6.90-7.05(m, 4H), 7.12-7.25(m, 3H), 13.25(brs, 1H)
979	-C ₄ H ₉	-H	-CH ₃	0.79(t; J=7.2Hz, 3H), 1.13(tt; J=7.2, 7.2Hz, 2H), 1.35(tt; J=7.2, 7.2Hz, 2H), 2.34-2.43(m, 2H), 2.70-2.80(m, 2H), 3.21(dd; J=9.5, 14.5Hz, 1H), 3.41(dd; J=4.7, 14.5Hz, 1H), 3.80(S, 3H), 3.93(t; J=7.2Hz, 2H), 4.94(dd; J=4.7, 9.5Hz, 1H), 6.95(d; J=8.8Hz, 1H), 6.97(d; J=8.8Hz, 1H), 13.20(brs, 1H)
980	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	-H	-CH ₃	0-0.07(m, 2H), 0.20-0.26(m, 2H), 0.73-0.84(m, 1H), 2.30-2.42(m, 2H), 2.70-2.85(m, 2H), 3.18(dd; J=9.1, 14.5Hz, 1H), 3.42(dd; J=4.7, 14.5Hz, 1H), 3.81(S, 3H), 3.84-3.90(m, 2H), 4.95(dd; J=4.7, 9.1Hz, 1H), 6.94(d; J=8.6Hz, 1H), 6.97(d; J=8.6Hz, 1H), 13.19(brs, 1H)
981	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-H	-CH ₃	2.39-2.47(m, 2H), 2.70-2.83(m, 2H), 3.14(dd; J=10.0, 14.5Hz, 1H), 3.40(dd; J=4.5, 14.5Hz, 1H), 3.79(S, 3H), 4.00-4.07(m, 2H), 4.20-4.30(m, 2H), 4.88(dd; J=4.5, 10.0Hz, 1H), 6.79(d, J=7.7Hz, 2H), 6.88(t, J=7.7Hz, 1H), 6.95(d, J=8.7Hz, 1H), 6.98(d, J=8.7Hz, 1H), 7.22(t, J=7.7Hz, 2H), 13.23(brs, 1H)

[0712]

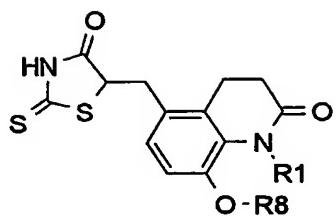
【表127】



実施例	R1	R2	R8	1H NMR (DMSO-d6) δ ppm
982	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	-CH ₃	0.71-0.80(m, 2H), 0.94-1.07(m, 3H), 1.20-1.27(m, 1H), 1.37-1.45(m, 2H), 1.45-1.59(m, 3H), 2.34-2.43(m, 2H), 2.70-2.80(m, 2H), 3.19(dd; J=9.2, 14.5Hz, 1H), 3.41(dd; J=4.9, 14.5Hz, 1H), 3.80(S, 3H), 3.88-3.99(m, 2H), 4.95(dd; J=4.9, 9.2Hz, 1H), 6.94(d, J=8.6Hz, 1H), 6.97(d, J=8.6Hz, 1H), 13.18(brs, 1H)
983	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	-CH ₃	2.34-2.43(m, 2H), 2.69-2.79(m, 2H), 3.08(S, 3H), 3.17(dd; J=9.6, 14.5Hz, 1H), 3.25-3.36(m, 2H), 3.41(dd; J=4.6, 14.5Hz, 1H), 3.80(S, 3H), 4.03-4.12(m, 2H), 4.93(dd; J=4.6, 9.6Hz, 1H), 6.95(d, J=8.6Hz, 1H), 6.98(d, J=8.6Hz, 1H), 13.21(brs, 1H)
984	-(CH ₂) ₄ C ₆ H ₅	-H	-OCH ₃	1.38-1.45(m, 4H), 2.33-2.42(m, 2H), 2.43-2.53(m, 2H), 2.69-2.80(m, 2H), 3.16(dd; J=9.7, 14.6Hz, 1H), 3.40(dd; J=4.6, 14.6Hz, 1H), 3.74(S, 3H), 3.88-3.96(m, 2H), 4.93(dd; J=4.6, 9.7Hz, 1H), 6.93(d, J=8.6Hz, 1H), 6.97(d, J=8.6Hz, 1H), 7.10(d, J=7.3Hz, 2H), 7.14(t, J=7.3Hz, 1H), 7.24(t, J=7.3Hz, 2H), 13.20(brs, 1H)
985	-(CH ₂) ₅ C ₆ H ₅	-H	-OCH ₃	1.05-1.16(m, 2H), 1.34-1.51(m, 4H), 2.31-2.41(m, 2H), 2.43-2.53(m, 2H), 2.64-2.72(m, 2H), 3.14(dd; J=9.7, 14.5Hz, 1H), 3.40(dd; J=4.6, 14.5Hz, 1H), 3.78(S, 3H), 3.87-3.96(m, 2H), 4.91(dd; J=4.6, 9.7Hz, 1H), 6.94(d, J=8.6Hz, 1H), 6.97(d, J=8.6Hz, 1H), 7.12(d, J=7.4Hz, 2H), 7.15(t, J=7.4Hz, 1H), 7.24(t, J=7.5Hz, 2H), 13.22(brs, 1H)

【0713】

【表128】

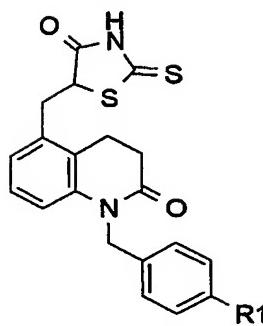


実施例	R1	R8	* ¹ H NMR δ ppm
986		-CH ₃	2.44-2.52 (2H, m), 2.83-2.89 (2H, m), 3.20-3.10 (1H, m), 3.36-3.42 (2H, m), 3.36-3.46 (1H, m), 3.66 (3H, s), 4.93 (1H, dd, J1=4.5Hz, J2=9.5Hz), 5.15 (2H, s), 6.84 (1H, d, J=8.6Hz), 6.92 (1H, d, J=8.6Hz), 7.54-7.57 (1H, m), 7.61-7.77 (3H, m), 8.11-8.13 (1H, m), 8.36 (1H, d, J=1.8Hz), 13.19 (1H, brs)
987		-CH ₃	2.47-2.53 (2H, m), 2.84-2.78 (2H, m), 3.15-3.21(2H, m), 3.15-3.45 (2H, m), 3.16 (3H, s), 3.72 (3H, s), 4.90-4.94 (1H, m), 5.01 (2H,s), 6.65 (1H, d, J=9.0Hz), 6.88-6.93 (2H, m), 7.36-7.39 (3H, m), 7.50-7.53 (3H, m), 7.85 (1H, s), 13.20 (1H, brs)
988		-CH ₃	2.55-2.60 (2H, m), 3.05-3.10 (2H, m), 3.13-3.48 (2H, m), 3.53 (3H, s), 4.93-4.99 (1H, m), 5.31 (2H,s), 6.84 (1H, d, J=8.5Hz), 6.93 (1H, d, J=8.5Hz), 7.34 (1H, d, J=8.6Hz), 7.50-7.56 (1H, m), 7.66-7.72 (1H, m), 7.88-7.95 (2H, m), 8.22 (1H, d, J=8.6Hz), 12.77 (1H, brs)
989		-OCH ₂ CO ₂ C(CH ₃) ₃	CDCl ₃ : 1.52(s, 9H), 2.6-2.7(m, 2H), 2.7-2.95(m, 2H), 3.1-3.2(m, 1H), 3.35-3.5(m, 1H), 4.39(s, 2H), 4.45-4.55(m, 1H), 5.4-5.55(m, 1H), 6.57(d, 1H, J=8.6Hz), 6.86(d, 1H, J=8.6Hz), 7.1-7.6(m, 9H), 8.96(br s)

*記載の無い場合測定溶媒 DMSO-d₆

【0714】

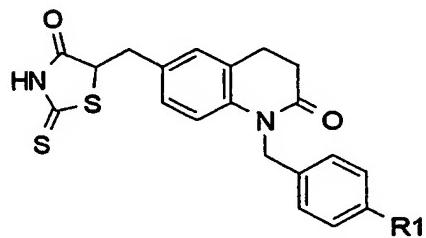
【表129】



実施例	R1	融点(°C)
990	-C ₆ H ₅	186.8-188.0
991	-Br	229.6-230.4
992	-Cl	214.6-215.4
993	-CH ₃	188.7-189.5

【0715】

【表130】



実施例	R1	融点(°C)
994	-Br	204.5-205.7
995	-C ₆ H ₅	186.3-187.1

【0716】

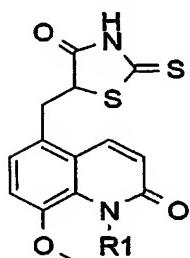
【表131】



実施例 R1	R8	融点(°C)
996	-H	204.1-205.9
997 -C ₆ H ₅	-H	223.6-225.4
998 -CH ₂ CH=CH ₂	-OCH ₃	156.5-158.5
999 -C ₈ H ₁₇	-OCH ₃	114.0-114.5

【0717】

【表132】



実施例 R1	融点(°C)
1000	249.5-250.2
1001 -(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	198.5-200.5

【0718】

製剤例1

1-メチル-8-メトキシ-5-(2-チオオキソ-5-チアゾリジニル)メチル-3,4-ジヒドロカルボスチリル	5 m g
デンプン	1 3 2 m g
マグネシウムステアレート	1 8 m g
乳糖	4 5 m g
計	2 0 0 m g

常法により、1錠中に上記組成を含有する錠剤を製造した。

【0719】

製剤例2

1-(2-フェニルエチル)-8-メトキシ-5-(2-チオオキソ-5-チアゾリジニル)メチル-3,4-ジヒドロカルボスチリル	5 g
ポリエチレングリコール(分子量: 4000)	0. 3 g
塩化ナトリウム	0. 9 g

ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート	0.4 g
メタ重亜硫酸ナトリウム	0.1 g
メチルーパラベン	0.18 g
プロピルーパラベン	0.02 g
注射用蒸留水	100 ml

上記パラベン類、メタ重亜硫酸ナトリウム及び塩化ナトリウムを攪拌しながら80℃で上記の蒸留水に溶解した。得られた溶液を40℃まで冷却し、本発明の化合物、ポリエチレングリコール及びポリオキシエチレンソルビタンモノオレエートを、上記溶液中に溶解させた。次にその溶液に注射用蒸留水を加えて最終の容量に調製し、適当なフィルターペーパーを用いて滅菌濾過して1mlずつアンプルに分注して、注射剤を調製した。

【0720】

試験例 1

試験化合物におけるヒトトレフォイルファクター2 (hTFF2) 遺伝子の転写亢進活性を hTFF2 遺伝子レポーター・アッセイにより評価した。

【0721】

(1) hTFF2遺伝子レポーターベクターpGL3-hTFF2proの作製

HeLa細胞 (CCL-2、大日本製薬株式会社) より、デオキシリボ核酸 (DNA) 抽出キット (DNeasy (トレードマーク) Tissue Kit、QIAGEN社製) を用い、DNAを抽出した。これを鑄型とし、ポリメラーゼチャーンリアクション (PCR) 法により、hTFF2プロモーター領域を増幅した。増幅領域は、ベックらの報告 (Beck S, Sommer P, Blin N, Gott P. (1998), 5'-flanking motifs control cell-specific expression of trefoil factor genes (TFF), Int J Mol Med. 2(3), 353-361) を参考とし、5'-CACGCGTCAGACTGGCAACCCCTGTC-3' と 5'-GAACGTTCTAGCTCAGCTGCACCCAG-3' をPCRプライマーに用いた。DNAポリメラーゼはPlatinum (登録商標) Pfx DNAポリメラーゼを、反応条件は変性 95℃ 30秒、アニーリング 55℃ 30秒、伸長反応 68℃ 75秒の32サイクルを用いた。

【0722】

PCR産物を1%アガロース電気泳動法により分離、精製した後、クローニングキットキット (Zero Blunt (登録商標) TOPO (登録商標) PCR Cloning Kit、Invitrogen社製) を用いて添付のpCR-BluntII-TOPOベクターにクローニングした。構築されたプラスミッドpCR-Blunt-TFF2proを形質転換用大腸菌 (TOP 10 UltracomptM (トレードマーク) Cells、Invitrogen社製) に導入し、30μg/mlのゼオシン (Zeocin、Invitrogen社製) を含むLB寒天培地にて形質転換株pCR-Blunt-TFF2pro/TOP10を選択培養した。pCR-Blunt-TFF2pro/TOP10を30μg/mlのゼオシンを含むLB培地50mlにて37℃で一晩振盪培養し、プラスミッド調整用キット (Concert (トレードマーク) High Purity Midiprep System、GIBCO BRL社製) を用いてプラスミッドを調製した。

【0723】

プラスミッドpCR-Blunt-TFF2proにクローニングされたPCR産物の塩基配列を決定した。その塩基配列を遺伝子バンク (GenBank accession AB038162) に報告されたhTFF2プロモーター領域の塩基配列と比較したところ、pCR-Blunt-TFF2proにクローニングされたMluI-HindIII領域の塩基配列はGenBank accession AB038162に完全に一致した (図1)。

【0724】

図1において、GenBank (accession AB038162) に報告されたhTFF2プロモーター領域の塩基配列及び塩基番号を上段に示した。下段には、pCR-Blunt-TFF2proプラスミッドにクローニングされたPCR産物の塩基配列を示した。下線部は制限酵素MluIの認識配列 (ACG CGT) とHindIIIの認識配列 (AAGCTT) を示した。MluI-HindIII領域の塩基配列は両者で完全に一致した。四角で囲んだATGは翻訳開始コドンを、矢印は転写開始位置を示した。

【0725】

プラスミッドpCR-Blunt-hTFF2proを制限酵素MluI及びHindIIIにて切断し、1%アガロース電気泳動法により分画後、核酸精製キット (ConcertTM (トレードマーク) Matrix Gel Extraction System、GIBCO BRL社製) を用いてhTFF2プロモーター領域を精製した

。市販のプラスミッドpGL-Basic (Promega社製) のMluI-HindIII領域にhTFF2プロモーター領域をライゲーション試薬 (Ligation high、東洋紡績株式会社製) を用いて挿入し、pGL3-hTFF2 proを構築した。プラスミッドpGL3-hTFF2 proを形質転換用大腸菌 (DH5 α Competent Cell、東洋紡績株式会社製) に導入し、100 μ g/m1アンピシリンを含むLB寒天培地にて形質転換株pGL3-hTFF2pro/DH5 α を選択培養した。

【0726】

pGL3-hTFF2pro/DH5 α を100 μ g/m1アンピシリンを含むLB培地400m1を入れた2リットル三角フラスコに接種し、37℃振盪培養器にて一晩200rpm振盪培養した。培養菌液からプラスミッド調整用キット (EndoFree Plasmid Maxi Kit、QIAGEN社製) を用い、プラスミッドpGL3-hTFF2proを抽出、精製した。

【0727】

葉剤選択マーカーを含む市販のベクターpWLneo (Stratagene社製) を形質転換用大腸菌 (DH5 α Competent Cell、東洋紡績株式会社製) に導入し、100 μ g/m1アンピシリンを含むLB寒天培地にて形質転換株pWLneo/DH5 α を選択培養した。pWLneo/DH5 α を100 μ g/m1アンピシリンを含むLB培地150m1を入れた1リットル三角フラスコに接種し、37℃振盪培養器にて一晩200rpm振盪培養した。培養菌液からプラスミッド調整用キット (EndoFree Plasmid Maxi Kit、QIAGEN社製) を用い、プラスミッドpWLneoを抽出、精製した。

【0728】

(2) hTFF2遺伝子レポーターアッセイ用細胞株pGL3-hTFF2pro・pWL-neo/MKN-45 #6-2の作製

ヒト胃癌細胞株MKN-45 (JCRB0254、ヒューマンサイエンス研究資源バンク) は、培地 (Iscove's Modified Dulbecco's Medium、SIGMA社製) 500m1に、56℃で30分間加温して非動化した牛胎児血清 (SIGMA社製) 50m1、ペニシリニーストレプトマイシン液 (SIGMA社製) 5m1、200mM L-グルタミン (SIGMA社製) 20m1を添加した培地 (IMDM培地) にて100cm径培養ディッシュ (CORNING社製) を用いて37℃、5%CO₂インキュベーターにて培養した。緩衝液 (Dulbecco's Phosphate Buffered Saline、SIGMA社製) で細胞を洗浄後、トリプシン (0.25% Tripsin-1 mM EDTA·4N a、SIGMA社製) 処理により細胞を浮遊させた。IMDM培地にて細胞を懸濁し、トリパンブルー染色液0.4% (Invitrogen社製) を用いて染色後、血球計算盤にてトリパンブルーにより染色されない細胞を生細胞として計測した。緩衝液 (Dulbecco's Phosphate Buffered Saline、SIGMA社製) で1回細胞を洗浄した後、10⁶個の生細胞を遺伝子導入溶液 (0.25M Mannitol-0.1 mM CaCl₂-0.1 mM MgCl₂-0.2 mM Tris-HCl、pH 7.2~7.4) に懸濁し、調製したプラスミッドpGL3-hTFF2pro 10 μ g及びプラスミッドpWLneo 2 μ gを添加した。プラスミッド添加細胞懸濁液を1mm幅のキュベット (Bio-Rad社製) に移し、細胞融合装置SSH-1 (島津製作所製) を用いて電気穿孔法により細胞に遺伝子を導入した。細胞をIMDM培地に懸濁し、10cm径培養ディッシュ (CORNING社製) に播種し、37℃、5%CO₂インキュベーターにて2日間培養した。その後400 μ g/m1ジェネティシン (Geneticin、Invitrogen社製) 含有IMDM培地を用いて選択培養を行った。はじめに、96ウェルプレート (FALCON社製) に100 μ l/ウェルにて播種し、増殖の見られた細胞は24ウェルプレート (FALCON社製) 、6ウェルプレート (FALCON社製) へと継代培養を行い、pGL3-hTFF2pro・pWL-neo/MKN-45 #6細胞を得た。pGL3-hTFF2pro・pWL-neo/MKN-45 #6細胞を400 μ g/m1ジェネティシン含有IMDM培地に懸濁し、96ウェルプレートに限界希釈法により播種し、クローニングを行った。これにより単一クローンpGL3-hTFF2pro・pWL-neo/MKN-45 #6-2を得た。pGL3-hTFF2pro・pWL-neo/MKN-45 #6-2細胞は、10cm径培養ディッシュで増殖させて回収し、凍結保存した。

【0729】

(3) pGL3-hTFF2pro・pWL-neo/MKN-45 #6-2細胞株を用いたhTFF2遺伝子レポーターアッセイ

pGL3-hTFF2pro・pWL-neo/MKN-45 #6-2細胞株は、凍結保存したものを融解し使用した。細胞は $400\mu\text{g}/\text{ml}$ ジェネティン含有IMDM培地を用い、10cm径培養ディッシュに播種し、3～5日毎に継代培養した。継代時に、緩衝液(Dulbecco's Phosphate Buffered Saline、SIGMA社製)で細胞を洗浄後、トリプシン(0.25% Tripsin-1 mM EDTA・4Na、SIGMA社製)を添加し、37℃、5分間処理により細胞を剥離した。IMDM培地を加えて細胞懸濁液を回収し、トリパンブルー染色液0.4% (Invitrogen社製)を用いて染色後、血球計算盤にてトリパンブルーにより染色されない細胞を生細胞として計測した。生存率が90%以上であることを確認し、htTF2遺伝子レポーターアッセイに用いた。

【0730】

試験化合物添加の前日に96ウェルプレート(COSTAR社製)に約 7.5×10^4 セル/ウェルの細胞を $100\mu\text{l}$ 播種し、37℃、5%CO₂インキュベーターで培養した。試験化合物は、ジメチルスルホキシド(和光純薬)で最終測定濃度の200倍に調製し、それぞれの濃度の試験化合物をIMDM培地で100倍希釈し、96ウェルプレートに $100\mu\text{l}/\text{ウェル}$ 添加した。試験化合物非添加のウェルにはジメチルスルホキシドをIMDM培地で100倍希釈し、添加した。試験化合物添加後、37℃、5%CO₂インキュベーターで24時間培養した。培養後、培養上清を除き、96ウェルプレートをディープフリーザー(SANYO製)に入れて凍結した。ルシフェラーゼ活性測定時に96ウェルプレートを室温に置いて融解し、ピッカジーンLT2.0(和光純薬製)を緩衝液(Dulbecco's Phosphate Buffered Saline、SIGMA社製)で2倍希釈した溶液を各ウェルに $100\mu\text{l}$ ずつ添加した。室温で30分以上静置し、ルミノスキャン(ICN Biomedicals Inc.社製)にてルシフェラーゼ活性を測定した。

【0731】

プレート毎のジメチルスルホキシド添加群の平均値を100%とし、各試験化合物群のジメチルスルホキシド添加群に対する百分率(コントロール%)を算出した。

【0732】

結果を次表に示す。

【0733】

【表133】

試験化合物	TFF2産生亢進活性
実施例22の化合物	++
実施例25の化合物	++
実施例32の化合物	+
実施例116の化合物	++
実施例122の化合物	++
実施例127の化合物	++
実施例133の化合物	++
実施例154の化合物	++
実施例157の化合物	++
実施例158の化合物	++
実施例164の化合物	++
実施例166の化合物	++
実施例171の化合物	++
実施例176の化合物	++
実施例184の化合物	++
実施例226の化合物	++
実施例233の化合物	++
実施例316の化合物	++
実施例349の化合物	++
実施例438の化合物	+
実施例607の化合物	+
実施例662の化合物	+
実施例685の化合物	++
実施例700の化合物	++
実施例740の化合物	+
実施例963の化合物	++
実施例965の化合物	++
実施例974の化合物	++
実施例981の化合物	++
実施例986の化合物	++
実施例992の化合物	++

【0734】

上記の表において、 10^{-6} Mの試験化合物濃度でTFF2産生亢進活性が1000%以上を示す場合に++、 10^{-6} Mの試験化合物濃度でTFF2産生亢進活性が300%以上を示す場合に+の記号を記した。

【図面の簡単な説明】

【0735】

【図1】図1は、プラスミッドpCR-Blunt-TFF2proにクローニングされたPCR産物の塩基配列と、遺伝子バンク (GenBank accession AB038162) に報告されたhTFF2プロモーター領域の塩基配列とを対比した図面である。

【書類名】図面

【図1】

15631 GCTCAACCAT CAGAACACAGA CTGGCAACCC CCTGTCATT CCCTGGCGTG
 ACGCGTCAGA CTGGCAACCC CCTGTCATT CCCTGGCGTG
 15681 GGGAACTTCG GGTCCCCCTCT GTCCCTTCCCA CCACACTTT CCCTCTTCT
 GGGAACTTCG GGTCCCCCTCT GTCCCTTCCCA CCACACTTT CCCTCTTCT
 15731 TTCCGGGTGT CTACTCTCTG GCTTCTGTCT TCTCTGTCA GTCCACAGAA
 TTCCGGGTGT CTACTCTCTG GCTTCTGTCT TCTCTGTCA GTCCACAGAA
 15781 TCCTTCTCCA GCACATCCTA CCCCAGGAAG GCCATGGGCT GGGTCCCAGG
 TCCTTCTCCA GCACATCCTA CCCCAGGAAG GCCATGGGCT GGGTCCCAGG
 15831 TGCCATCTTT CAGAAGATGT AGAGCATTC CATGGAACAA AAATAACCCA
 TGCCATCTTT CAGAAGATGT AGAGCATTC CATGGAACAA AAATAACCCA
 15881 TTTCAGGGGT TGGCTGAAAA TGAACCTATT AAAACCTGCC TGTACAGGC
 TTTCAGGGGT TGGCTGAAAA TGAACCTATT AAAACCTGCC TGTACAGGC
 15931 TACTCCGCTG ACCCTGTCA GTCCATCTCC ATGGAGAGCA GCCCCTCCTG
 TACTCCGCTG ACCCTGTCA GTCCATCTCC ATGGAGAGCA GCCCCTCCTG
 15981 CTGAAGATGG GACAAAGGGC ATCGTGCTGC GGTTGGGAG GCTCTAACCA
 CTGAAGATGG GACAAAGGGC ATCGTGCTGC GGTTGGGAG GCTCTAACCA
 16031 CAGCCCTGGG AGCAGTCTCT TACCTCCTCT GAGATGCTC CCTTCCTCAG
 CAGCCCTGGG AGCAGTCTCT TACCTCCTCT GAGATGCTC CCTTCCTCAG
 16081 GGAGGGGACT TTTCCATGCT ATCTGCTGGC CTGTACATT TCCCCAGTAA
 GGAGGGGACT TTTCCATGCT ATCTGCTGGC CTGTACATT TCCCCAGTAA
 16131 ACTTGGCCCT AATATTTCT AAATTCCTGT GGTCCCTGCC CACTCTATCA
 ACTTGGCCCT AATATTTCT AAATTCCTGT GGTCCCTGCC CACTCTATCA
 16181 ATAGAAAATGC ATAGCTTATC CCTTCCTGGG TGTGACCCCTG TGTGTGCCA
 ATAGAAAATGC ATAGCTTATC CCTTCCTGGG TGTGACCCCTG TGTGTGCCA
 16231 GCCCCAGACC TGCACGTGGC CGGTTTCCA CGCTGGCAGC CTGGCATGAC
 GCCCCAGACC TGCACGTGGC CGGTTTCCA CGCTGGCAGC CTGGCATGAC
 16281 CCAAACCTCT GTCCAGGGCA GGAAGAGGTA TCACCGAGCA GGGAGAGAGT
 CCAAACCTCT GTCCAGGGCA GGAAGAGGTA TCACCGAGCA GGGAGAGAGT
 16331 CACCCCTGGCC CGGAAGCCTC GCCTGCACAG GGCACAGCTG CCTCTTGCCT
 CACCCCTGGCC CGGAAGCCTC GCCTGCACAG GGCACAGCTG CCTCTTGCCT
 16381 CCTCTCGCC TCCACGGTGG AAGGGCTGGG GCCACGGGGC AGAGAAGAAA
 CCTCTCGCC TCCACGGTGG AAGGGCTGGG GCCACGGGGC AGAGAAGAAA
 16431 GGTTATCTCT GCTTGTGG AAACACAGAGG GGAGATTATA AACATACCC
 GGTTATCTCT GCTTGTGG AAACACAGAGG GGAGATTATA AACATACCC
 16481 GGCAGTGGAC ACCATGCATT CTGCAAGCCA CCCTGGGGTG CAGCTGAGCT
 GGCAGTGGAC ACCATGCATT CTGCAAGCCA CCCTGGGGTG CAGCTGAGCT
 16531 AGACATGGGA CGGCGAGACG CCCAGCTCCT
 AGAAGCTT

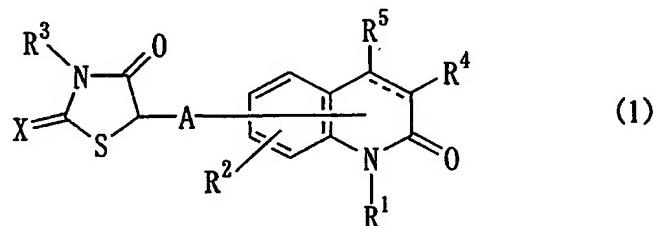
【書類名】要約書

【要約】

【課題】 本発明は、TFF2を選択的に產生誘導し得る新規な化合物を提供するを提供することを課題とする。

【解決手段】 本発明は、一般式(1)

【化1】



[式中、Aは直接結合、低級アルキレン基又は低級アルキリデン基を、Xは酸素原子又は硫黄原子を、R⁴及びR⁵はそれぞれ水素原子を、カルボスチリル骨格の3, 4位の結合は一重結合又は二重結合を、R¹は水素原子等を、R²は水素原子等を、R³は水素原子等を示す。]

で表されるカルボスチリル誘導体又はその塩を提供する。

【選択図】 なし

特願2004-282814

出願人履歴情報

識別番号

[000206956]

1. 変更年月日

1990年 8月27日

[変更理由]

新規登録

住 所

東京都千代田区神田司町2丁目9番地

氏 名

大塚製薬株式会社

Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/JP05/018217

International filing date: 26 September 2005 (26.09.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: JP
Number: 2004-282814
Filing date: 28 September 2004 (28.09.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 28 November 2005 (28.11.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Geneva, Switzerland
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record.**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.